

[19] 中华人民共和国国家知识产权局



[12] 发明专利说明书

专利号 ZL 00813428.6

[51] Int. Cl.

C07D 231/32 (2006.01)
C07D 231/34 (2006.01)
C07D 231/36 (2006.01)
C07D 491/04 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)

[45] 授权公告日 2006年8月30日

[11] 授权公告号 CN 1272324C

[51] Int. Cl. (续)

C07D 409/12 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
C07D 207/38 (2006.01)
C07D 491/10 (2006.01)
C07D 209/96 (2006.01)
C07D 307/60 (2006.01)
C07D 307/94 (2006.01)
C07D 493/10 (2006.01)

[22] 申请日 2000.9.5 [21] 申请号 00813428.6

[30] 优先权

[32] 1999.9.7 [33] CH [31] 1642/99

[86] 国际申请 PCT/EP2000/008656 2000.9.5

[87] 国际公布 WO2001/017972 德 2001.3.15

[85] 进入国家阶段日期 2002.3.27

[71] 专利权人 辛根塔参与股份公司

地址 瑞士巴塞尔

[72] 发明人 T·梅兹克 A·斯多勒

S·温德波恩 H·茨克采潘斯基

审查员 何湘琼

[74] 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利
商标事务所

代理人 杜京英

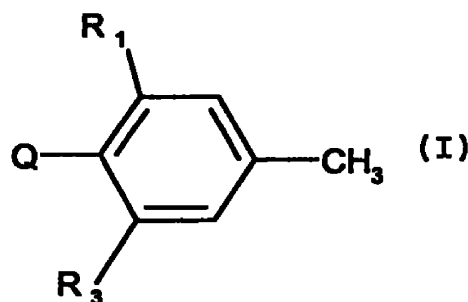
权利要求书 3 页 说明书 102 页

[54] 发明名称

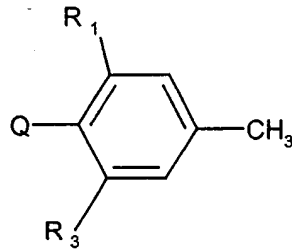
新颖的除草剂

[57] 摘要

式 I 化合物, 和这些化合物的农用盐、异构体和对映异构体适用于用作除草剂, 其中的取代基如权利要求 1 中所定义。



1. 下式 I 化合物, 或这些化合物的农用盐、异构体和对映异构体:

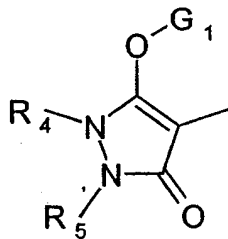


(I)

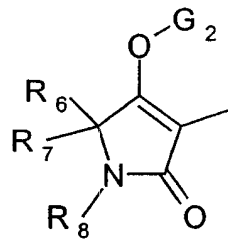
其中

R_1 和 R_3 各自相互独立地是乙基、 C_1 - C_2 烷氧基;

Q 是下述基团:



(Q₁)



(Q₂)

R_4 和 R_5 与它们所键合的原子一起形成5-至7-元环的基团, 该环可含有稠合或螺-键合的由2-6个碳原子组成的亚烷基或亚链烯基链, 该链又可含有一个或二个氧原子, 其中所述的环基团可以被下述基团取代: 卤素、 C_3 - C_6 环烷基、羟基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 烷氧基- C_1 - C_6 烷氧基;

R_6 是 C_1 - C_{10} 烷基;

R_7 是 C_1 - C_{10} 烷基;

R_8 是氢、 C_1 - C_{10} 烷基; 或

R_6 和 R_7 与它们所键合的原子一起形成饱和的3-至7-元环基团, 该环基团可含有一个或二个选自氮、氧的杂原子; 或 R_6 和 R_8 与它们所键合

的原子一起形成5-至7-元环基团；

G_1 、 G_2 各自相互独立地是氢、 $-C(X_1)-R_{20}$ ；

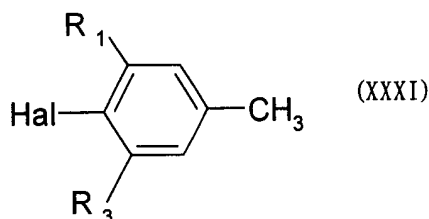
X_1 是氧或硫；

R_{20} 是 C_1-C_{10} 烷基。

2. 制备权利要求1式I化合物的方法，该方法包括使式XXX化合物：



其中Q是 Q_1 、 Q_2 ，除 G_1 、 G_2 以外，它们的取代基具有上述权利要求1中所述定义， G_1 、 G_2 是氢，
与下式XXXI化合物进行反应：



其中 R_1 和 R_3 如上述权利要求1中所述定义，和Hal是氯、溴或碘，反应在惰性溶剂、碱和钯催化剂存在下于30-250℃下进行。

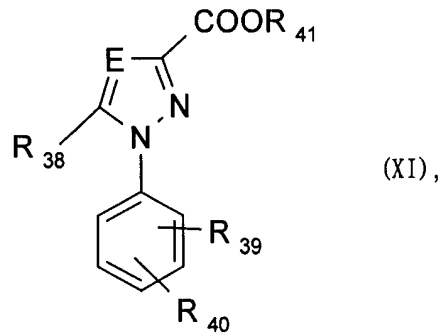
3. 一种除草和抑制植物生长的组合物，该组合物含有除草有效量的式I化合物以及惰性载体。

4. 一种控制不需要的植物生长的方法，该方法包括向所述的植物或其场所施用除草有效量的式I的活性成分，或含有这些活性成分的组合物。

5. 一种抑制植物生长的方法，该方法包括向所述的植物或其场所施用除草有效量的式I的活性成分，或含有这些活性成分的组合物。

6. 一种选择性除草组合物，该组合物除了常规的惰性剂型助剂之外，作为活性成分包含下述(a)和(b)的混合物：

- a) 除草有效量的权利要求1的式 I 化合物，条件是Q不是Q₁；和
b) 拮抗除草剂有效量的下式XI化合物：



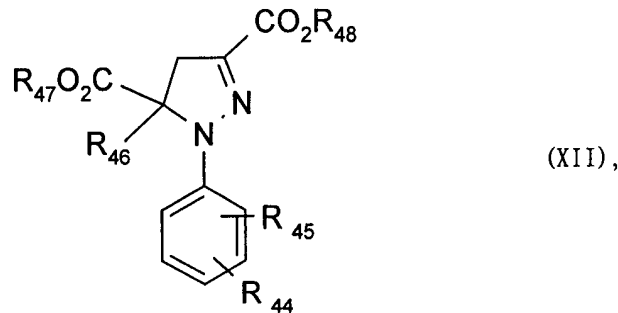
其中E是氮或次甲基；

R₃₈是-CCl₃、苯基或卤素取代的苯基；

R₃₉和R₄₀各自相互独立地是氢或卤素；和

R₄₁是C₁-C₄烷基；

或下式XII化合物：



其中R₄₄和R₄₅各自相互独立地是氢或卤素，R₄₆、R₄₇和R₄₈各自相互独立地是C₁-C₄烷基。

7. 权利要求3的组合物，其含有喷雾桶混助剂。

8. 权利要求6的组合物，其含有喷雾桶混助剂。

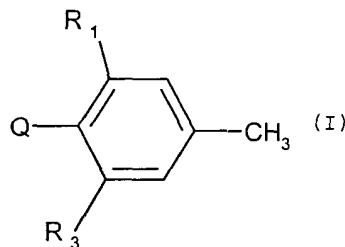
新颖的除草剂

本发明涉及新的具有除草活性的苯基取代杂环、其制备方法、含有这些化合物的组合物、以及该化合物在控制杂草，特别是在有用的作物中控制杂草，或抑制植物生长方面的应用。

已有报道说3-羟基-4-芳基-5-氧代-吡唑啉衍生物具有除草活性，例如EP-A-0 508 126、WO 96/25395和WO 96/21652所述。

现已发现具有除草活性和抑制植物生长性能的苯基取代杂环。

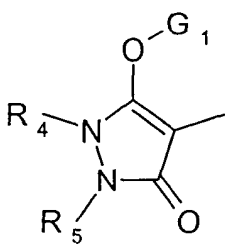
本发明涉及下述化合物，以及这些化合物的农用盐、异构体和对映异构体：



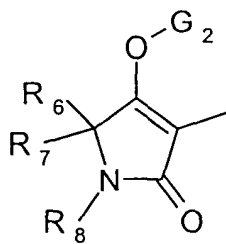
其中

R₁和R₃各自相互独立地是乙基，卤代乙基，乙炔基，C₁-C₂烷氧基，C₁-C₂卤代烷氧基，C₁-C₂烷基羰基，C₁-C₂羟基烷基或C₁-C₂烷氧羰基；

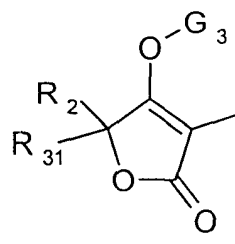
Q是下述基团：



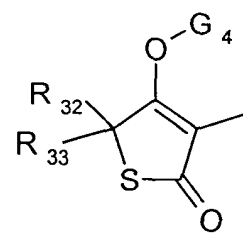
(Q₁),



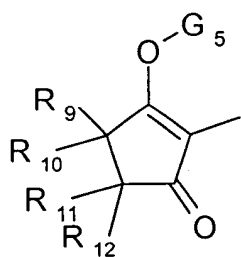
(Q₂),



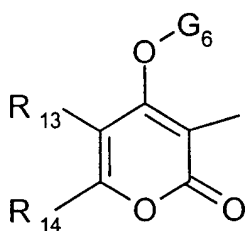
(Q₃),



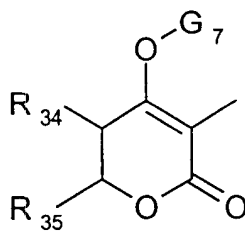
(Q₄),



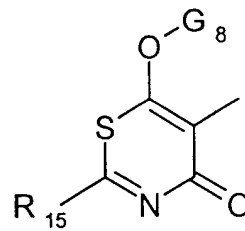
(Q5),



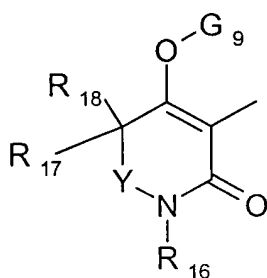
(Q6),



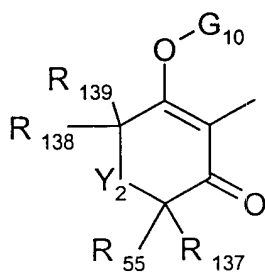
(Q7),



(Q8)



(Q9) 或



(Q10) ;

R_4 和 R_5 各自相互独立地是 C_1 - C_{10} 烷基, C_2 - C_{10} 链烯基, C_2 - C_{10} 链炔基, C_1 - C_{10} 卤代烷基, C_2 - C_{10} 烷氧基烷基, C_3 - C_{10} 链烯氧基烷基, C_3 - C_{10} 链炔氧基烷基, C_2 - C_{10} 烷硫基烷基, C_2 - C_{10} 烷基亚磺酰基烷基, C_2 - C_{10} 烷基磺酰基烷基, C_2 - C_{10} 烷基羰基烷基, C_2 - C_{10} -N-烷氧基氨基烷基, C_2 - C_{10} 烷氧羰基烷基, C_1 - C_{10} 氨基烷基, C_3 - C_{10} 二烷基氨基烷基, C_2 - C_{10} 烷基氨基烷基, C_1 - C_{10} 氰基烷基, C_4 - C_{10} 环烷基烷基, C_1 - C_{10} 苯基烷基, C_1 - C_{10} -杂芳基烷基, C_1 - C_{10} 苯氧基烷基, C_1 - C_{10} 杂芳氧基烷基, C_1 - C_{10} 亚烷基氨基氧基烷基, C_1 - C_{10} 硝基烷基, C_1 - C_{10} 三烷基甲硅烷基烷基, C_2 - C_{10} 烷基氨基羰基烷基, C_2 - C_{10} 二烷基氨基羰基烷基, C_2 - C_{10} 烷基氨基羰氧基烷基, C_3 - C_{10} 二烷基氨基羰氧基烷基, C_2 - C_{10} 烷氧羰基氨基烷基, C_1 - C_{10} -N-烷氧羰基-N-烷基氨基烷基, C_1 - C_{10} 环烷基, 芳基或杂芳基; 或

R_4 和 R_5 与它们所键合的原子一起形成5-至7-元环的基团, 该环可含有一个或两个选自氮、氧和硫的杂原子, 此外该环还可含有稠合或螺-键合的由2-6个碳原子组成的亚烷基或亚链烯基链, 该链又可含有一个或二个选自氧或硫的杂原子, 其中的环基可被苯基或苄基取代, 而它们又可以被下述基团取代: 卤素、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 卤代烷基、 C_3 - C_6 环

烷基、羟基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷氧基- C_1-C_5 烷氧基、 C_1-C_6 卤代烷氧基或硝基；

R_2 、 R_6 和 R_{32} 各自相互独立地是 C_1-C_{10} 烷基， C_2-C_{10} 链烯基， C_2-C_{10} 链炔基， C_1-C_{10} 卤代烷基， C_2-C_{10} 烷氧基烷基， C_3-C_{10} 链烯氧基烷基， C_3-C_{10} 链炔氧基烷基， C_2-C_{10} 烷硫基烷基， C_2-C_{10} 烷基亚磺酰基烷基， C_2-C_{10} 烷基磺酰基烷基， C_2-C_{10} 烷基羰基烷基， C_3-C_{10} -环烷基，芳基或杂芳基；

R_7 、 R_{31} 和 R_{33} 各自相互独立地是氢， C_1-C_{10} 烷基， C_2-C_{10} 链烯基， C_2-C_{10} 链炔基或 C_2-C_{10} 烷氧基烷基；

R_8 是氢， C_1-C_{10} 烷基， C_1-C_{10} 卤代烷基， C_2-C_{10} 烷氧基烷基， C_3-C_{10} 链烯氧基烷基， C_3-C_{10} 链炔氧基烷基， C_2-C_{10} 烷硫基烷基， C_2-C_{10} 烷基亚磺酰基烷基， C_2-C_{10} 烷基磺酰基烷基， C_3-C_{10} -环烷基，芳基或杂芳基；或

R_6 和 R_7 或 R_2 和 R_{31} 或 R_{32} 和 R_{33} 与它们所键合的原子一起形成饱和的3-至7-元环基团，该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子；或 R_6 和 R_8 与它们所键合的原子一起形成5-至7-元环基团，该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子；

R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 和 R_{12} 各自相互独立地是 C_1-C_{10} 烷基， C_2-C_{10} 链烯基， C_2-C_{10} -链炔基， C_1-C_{10} 卤代烷基， C_2-C_{10} 烷氧基烷基， C_3-C_{10} 链烯氧基烷基， C_3-C_{10} 链炔氧基烷基， C_2-C_{10} 烷硫基烷基， C_2-C_{10} 烷基亚磺酰基烷基， C_2-C_{10} 烷基磺酰基烷基， C_2-C_{10} 烷基羰基烷基， C_3-C_{10} 环烷基，芳基或杂芳基；或

R_9 和 R_{11} 或 R_9 和 R_{10} 与它们所键合的原子一起形成5-至7-元环基团，该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子；

R_{13} 、 R_{14} 、 R_{34} 和 R_{35} 各自相互独立地是 C_1-C_{10} 烷基， C_2-C_{10} 链烯基， C_2-C_{10} -链炔基， C_1-C_{10} 卤代烷基， C_2-C_{10} 烷氧基烷基， C_3-C_{10} 链烯氧基烷基， C_3-C_{10} 链炔氧基烷基， C_2-C_{10} 烷硫基烷基， C_2-C_{10} 烷基亚磺酰基烷基， C_2-C_{10} 烷基磺酰基烷基， C_2-C_{10} 烷基羰基烷基， C_3-C_{10} 环烷基，芳基或杂芳基；或

R_{13} 和 R_{14} 或 R_{34} 和 R_{35} 与它们所键合的原子一起形成5-至7-元环基团，该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子；

R_{15} 是 C_1-C_{10} 烷基， C_2-C_{10} 链烯基， C_2-C_{10} 链炔基， C_1-C_{10} 卤代烷基， C_2-C_{10}

烷氧基烷基, C_3-C_{10} 链烯氧基烷基, C_3-C_{10} 链炔氧基烷基, C_2-C_{10} 烷硫基烷基, C_2-C_{10} 烷基亚磺酰基烷基, C_2-C_{10} 烷基磺酰基烷基, C_2-C_{10} 烷基羰基烷基, C_2-C_{10} 烷氧羰基烷基, C_1-C_{10} 氨基烷基, C_3-C_{10} 二烷基氨基烷基, C_2-C_{10} 烷基氨基烷基, C_1-C_{10} 氰基烷基, C_4-C_{10} 环烷基烷基, C_1-C_{10} 苯基烷基, C_1-C_{10} 杂芳基烷基, C_1-C_{10} 苯氧基烷基, C_1-C_{10} 杂芳氧基烷基, C_1-C_{10} 硝基烷基, C_3-C_{10} 环烷基, 芳基或杂芳基;

R_{16} 是 C_1-C_{10} 烷基, C_2-C_{10} 链烯基, C_2-C_{10} 链炔基, C_1-C_{10} 卤代烷基, C_2-C_{10} 烷氧基烷基, C_3-C_{10} 链烯氧基烷基, C_3-C_{10} 链炔氧基烷基, C_2-C_{10} 烷硫基烷基, C_2-C_{10} 烷基亚磺酰基烷基, C_2-C_{10} 烷基磺酰基烷基, C_3-C_{10} 环烷基, 芳基或杂芳基;

R_{17} 是 C_1-C_{10} 烷基, C_2-C_{10} 链烯基, C_2-C_{10} 链炔基, C_1-C_{10} 卤代烷基, C_2-C_{10} 烷氧基烷基, C_3-C_{10} 链烯氧基烷基, C_3-C_{10} 链炔氧基烷基, C_2-C_{10} 烷硫基烷基, C_2-C_{10} 烷基亚磺酰基烷基, C_2-C_{10} 烷基磺酰基烷基, C_2-C_{10} 烷基羰基烷基, C_3-C_{10} 环烷基, 芳基或杂芳基;

R_{18} 是氢, C_2-C_{10} 链烯基, C_2-C_{10} 链炔基, C_1-C_{10} 烷基或 C_1-C_{10} 烷氧基烷基; 或

R_{17} 和 R_{18} 与它们所键合的原子一起形成3-至7-元环基团, 该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子;

Y是氧, 硫, C- R_{19} 或N- R_{36} ;

R_{19} 和 R_{36} 各自相互独立地是 C_1-C_{10} 烷基, C_1-C_{10} 卤代烷基, 苯基或杂芳基; 或

R_{18} 和 R_{19} 或 R_{18} 和 R_{36} 与它们所键合的原子一起形成饱和的5-至7-元环基团, 该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子;

G_1 、 G_2 、 G_3 、 G_4 、 G_5 、 G_6 、 G_7 、 G_8 、 G_9 和 G_{10} 各自相互独立地是氢, $-C(XI)-R_{20}$, $-C(X_2)-X_3-R_{21}$, $-C(X_4)-N(R_{22})-R_{23}$, $-SO_2-R_{24}$, 碱金属阳离子, 碱土金属阳离子, 铕氧离子或铵氧离子, $-P(X_5)(R_{25})-R_{26}$ 或 $-CH_2-X_6-R_{27}$;

XI、 X_2 、 X_3 、 X_4 、 X_5 和 X_6 各自相互独立地是氧或硫;

R_{20} 、 R_{21} 、 R_{22} 和 R_{23} 各自相互独立地是氢, C_1-C_{10} 烷基, C_2-C_{10} 链烯基, C_2-C_{10} 链炔基, C_1-C_{10} 卤代烷基, C_1-C_{10} 氰基烷基, C_1-C_{10} 硝基烷基, C_1-C_{10}

氨基烷基, C_1-C_5 烷基氨基- C_1-C_5 烷基, C_2-C_8 二烷基氨基- C_1-C_5 烷基, C_3-C_7 环烷基- C_1-C_5 烷基, C_2-C_{10} 烷氧基烷基, C_4-C_{10} 链烯氧基烷基, C_4-C_{10} 链炔氧基烷基, C_2-C_{10} 烷硫基烷基, C_1-C_5 -烷基亚磺酰基(sulfoxy)- C_1-C_5 烷基, C_1-C_6 烷基磺酰基- C_1-C_5 烷基, C_2-C_8 亚烷基氨基氧基- C_1-C_5 烷基, C_1-C_5 烷基羰基- C_1-C_5 烷基, C_1-C_5 烷氧羰基- C_1-C_5 烷基, C_1-C_5 氨基羰基- C_1-C_5 -烷基, C_2-C_8 二烷基氨基羰基- C_1-C_5 烷基, C_1-C_5 烷基羰基氨基- C_1-C_5 烷基, C_1-C_5 烷基-羰基-(C_2-C_5 烷基)-氨基烷基, C_3-C_8 三烷基甲硅烷基- C_1-C_5 烷基, 苯基- C_1-C_5 烷基, 杂芳基- C_1-C_5 烷基, 苯氧基- C_1-C_5 烷基, 杂芳氧基- C_1-C_5 烷基, C_2-C_5 链烯基, C_2-C_5 卤代链烯基, C_3-C_8 环烷基, 苯基, 或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的苯基, 或杂芳基或杂芳基氨基, 或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的杂芳基或杂芳基氨基, 二杂芳基氨基, 或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的二杂芳基氨基, 或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的苯基氨基, 二苯基氨基, 或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的二苯基氨基, 或 C_3-C_7 -环烷基氨基, 二- C_3-C_7 环烷基氨基或 C_3-C_7 环烷氧基;

R_{24} 、 R_{25} 和 R_{26} 是氢, C_1-C_{10} 烷基, C_2-C_{10} 链烯基, C_2-C_{10} 链炔基, C_1-C_{10} 卤代烷基, C_1-C_{10} 氰基烷基, C_1-C_{10} 硝基烷基, C_1-C_{10} 氨基烷基, C_1-C_5 烷基氨基- C_1-C_5 烷基, C_2-C_8 -二烷基氨基- C_1-C_5 烷基, C_3-C_7 环烷基- C_1-C_5 烷基, C_2-C_{10} 烷氧基烷基, C_4-C_{10} 链烯氧基烷基, C_4-C_{10} 链炔氧基烷基, C_2-C_{10} 烷硫基烷基, C_1-C_5 烷基亚磺酰基- C_1-C_5 烷基, C_1-C_5 烷基磺酰基- C_1-C_5 烷基, C_2-C_8 亚烷基氨基氧基- C_1-C_5 烷基, C_1-C_5 烷基羰基- C_1-C_5 烷基, C_1-C_5 烷氧基-羰基- C_1-C_5 烷基, C_1-C_5 氨基羰基- C_1-C_5 烷基, C_2-C_8 二烷基氨基羰基- C_1-C_5 烷基, C_1-C_5 烷基羰基氨基- C_1-C_5 烷基, C_1-C_5 烷基羰基-(C_2-C_5 烷基)-氨基烷基, C_3-C_8 -三烷基甲硅烷基- C_1-C_5 烷基, 苯基- C_1-C_5 烷基, 杂芳基- C_1-C_5 烷基, 苯氧基- C_1-C_5 烷基, 杂芳氧基- C_1-C_5 烷基, C_2-C_5 链烯基,

C₂-C₆卤代链烯基, C₃-C₈环烷基, 苯基, 或被C₁-C₃烷基、C₁-C₃卤代烷基、C₁-C₃烷氧基、C₁-C₃卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的苯基, 或杂芳基或杂芳基氨基, 或被C₁-C₃烷基、C₁-C₃卤代烷基、C₁-C₃烷氧基、C₁-C₃卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的杂芳基或杂芳基氨基, 二杂芳基氨基, 或被C₁-C₃烷基、C₁-C₃卤代烷基、C₁-C₃烷氧基、C₁-C₃卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的二杂芳基氨基, 苯基氨基, 或被C₁-C₃烷基、C₁-C₃卤代烷基、C₁-C₃烷氧基、C₁-C₃卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的苯基氨基, 二苯基氨基, 或被C₁-C₃烷基、C₁-C₃卤代烷基、C₁-C₃烷氧基、C₁-C₃卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的二苯基氨基, 或C₃-C₇环烷基氨基, 二-C₃-C₇环烷基氨基, C₃-C₇环烷氧基, C₁-C₁₀烷氧基, C₁-C₁₀卤代烷氧基, C₁-C₅烷基氨基, C₂-C₈二烷基氨基, 苄氧基或苯氧基, 其中苄氧基和苯基又可被C₁-C₃烷基、C₁-C₃卤代烷基、C₁-C₃烷氧基、C₁-C₃卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代;

R₂₇是C₁-C₁₀烷基, C₂-C₁₀链烯基, C₂-C₁₀链炔基, C₁-C₁₀卤代烷基, C₁-C₁₀氰基烷基, C₁-C₁₀硝基烷基, C₁-C₁₀氨基烷基, C₁-C₅烷基氨基-C₁-C₅烷基, C₂-C₈二烷基氨基-C₁-C₅烷基, C₃-C₇环烷基-C₁-C₅烷基, C₂-C₁₀烷氧基烷基, C₄-C₁₀链烯氧基烷基, C₄-C₁₀链炔氧基烷基, C₂-C₁₀烷硫基烷基, C₁-C₅烷基亚磺酰基-C₁-C₅烷基, C₁-C₅烷基磺酰基-C₁-C₅烷基, C₂-C₈亚烷基氨基氧基-C₁-C₅烷基, C₁-C₅烷基羰基-C₁-C₅烷基, C₁-C₅烷氧羰基-C₁-C₅烷基, C₁-C₅氨基羰基-C₁-C₅烷基, C₂-C₈二烷基氨基羰基-C₁-C₅烷基, C₁-C₅烷基羰基-氨基-C₁-C₅烷基, C₁-C₅烷基羰基-(C₂-C₅烷基)-氨基烷基, C₃-C₆三烷基甲硅烷基-C₁-C₅烷基, 苯基-C₁-C₅烷基, 杂芳基-C₁-C₅烷基, 苯氧基-C₁-C₅烷基, 杂芳氧基-C₁-C₅烷基, C₂-C₅链烯基, C₂-C₆卤代链烯基, C₃-C₈环烷基, 苯基, 或被C₁-C₃烷基、C₁-C₃卤代烷基、C₁-C₃烷氧基、C₁-C₃卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的苯基, 或杂芳基或杂芳基氨基, 或被C₁-C₃烷基、C₁-C₃卤代烷基、C₁-C₃烷氧基、C₁-C₃卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的杂芳基或杂芳基氨基, 二杂芳基氨基, 被C₁-C₃烷基、C₁-C₃卤代烷基、C₁-C₃烷氧基、C₁-C₃卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的二杂芳基氨基, 或苯基氨基, 被C₁-C₃烷基、C₁-C₃卤代烷基、C₁-C₃

烷氧基、 C_1 - C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的苯基氨基，二苯基氨基，被 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 卤代烷基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的二苯基氨基， C_3 - C_7 环烷基氨基，二- C_3 - C_7 环烷基氨基， C_3 - C_7 环烷氧基或 C_1 - C_{10} 烷基-羰基；

Y_2 是氧，硫， $C-R_{140}-R_{141}$ 或 $N-R_{142}$ ，

R_{55} 是 C_1 - C_{10} 烷基， C_2 - C_{10} 链烯基， C_2 - C_{10} 链炔基， C_1 - C_{10} 卤代烷基， C_2 - C_{10} 烷氧基烷基， C_3 - C_{10} 链烯氧基烷基， C_3 - C_{10} 链炔氧基烷基， C_2 - C_{10} 烷硫基烷基， C_2 - C_{10} 烷基亚磺酰基烷基， C_2 - C_{10} 烷基磺酰基烷基， C_2 - C_{10} 烷基羰基烷基， C_3 - C_{10} 环烷基，芳基或杂芳基；

R_{137} 是氢， C_1 - C_{10} 烷基， C_2 - C_{10} 链烯基， C_2 - C_{10} 链炔基或 C_1 - C_{10} 烷氧基烷基；或

R_{55} 和 R_{137} 与它们所键合的原子一起形成3-至7-元环基团，该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子；

R_{138} 和 R_{139} 各自相互独立地是氢， C_1 - C_{10} 烷基， C_2 - C_{10} 链烯基， C_2 - C_{10} 链炔基或 C_2 - C_{10} 烷氧基烷基；和

R_{140} 和 R_{141} 各自相互独立地是氢， C_1 - C_{10} 烷基， C_2 - C_{10} 链烯基， C_2 - C_{10} 链炔基或 C_1 - C_{10} 烷氧基烷基；或

R_{55} 和 $C-R_{140}$ 与它们所键合的原子一起形成饱和或不饱和的3-至7-元环基团，该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子；

R_{142} 是氢， C_1 - C_{10} 烷基， C_1 - C_{10} 卤代烷基， C_2 - C_{10} 烷氧基烷基， C_3 - C_{10} 链烯氧基烷基， C_3 - C_{10} 链炔氧基烷基， C_2 - C_{10} 烷硫基烷基， C_2 - C_{10} 烷基亚磺酰基烷基， C_2 - C_{10} 烷基磺酰基烷基， C_3 - C_{10} 环烷基，芳基或杂芳基；或

R_{55} 和 $N-R_{142}$ 与它们所键合的原子一起形成饱和或不饱和的3-至7-元环基团，该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子。

出现在所述取代基定义中的烷基基团可以是直链或支链的，例如甲基，乙基，正丙基，异丙基，正丁基，仲丁基，异丁基，叔丁基，和戊基，己基，庚基，辛基，壬基与癸基的异构体。卤代烷基例如是氟甲基，二氟甲基，三氟甲基，氯甲基，二氯甲基，三氯甲基，2,2,2-三氟乙基，2-氟乙基，2-氯乙基，五氟乙基，1,1-二氟-2,2,2-三氟乙

基, 2, 2, 3, 3-四氟乙基和2, 2, 2-三氯乙基; 优选三氯甲基, 二氟氯甲基, 二氟甲基, 三氟甲基或二氟氯甲基。烷氧基烷基例如是甲氧基甲基, 乙氧基甲基, 丙氧基乙基, 异丙氧基乙基, 正丁氧基甲基, 异丁氧基-正丁基, 仲丁氧基甲基和叔丁氧基异丙基, 优选甲氧基甲基和乙氧基甲基。烷氧基, 链烯基, 链炔基, 烷氧基烷基, 烷硫基, 烷基磺酰基, 烷基氨基羰基, 二烷基氨基羰基, 烷基氨基烷基, 苯基烷基, 硝基烷基, 氨基烷基和N-烷氧羰基-N-烷基氨基烷基基团均是由所述的烷基基团衍生的基团。链烯基和链炔基基团可以是一或多不饱和的。应当理解的是, 链烯基例如是乙烯基, 烯丙基, 甲代烯丙基, 1-甲基乙烯基或丁-2-烯-1-基。链炔基例如是乙炔基, 炔丙基, 丁-2-炔-1-基, 2-甲基丁炔-2-基或丁-3-炔-2-基。链炔基例如是乙炔基, 炔丙基, 丁-2-炔-1-基, 2-甲基丁炔-2-基或丁-3-炔-2-基。卤代烷基基团优选链长为1-4个碳原子。卤代烷基例如是氟甲基, 二氟甲基, 三氟甲基, 氯甲基, 二氯甲基, 三氯甲基, 2, 2, 2-三氟乙基, 2-氟乙基, 2-氯乙基, 五氟乙基, 1, 1-二氟-2, 2, 2-三氯乙基, 2, 2, 3, 3-四氟乙基或2, 2, 2-三氯乙基; 优选三氯甲基, 二氟氯甲基, 二氟甲基, 三氟甲基或二氟氯甲基。适当的卤代链烯基基团包括被卤素一或多取代的链烯基, 卤素是氟、氯、溴或碘, 特别是氟或氯, 例如2, 2-二氟-1-甲基乙烯基, 3-氟丙烯基, 3-氯丙烯基, 3-溴丙烯基, 2, 3, 3-三氟丙烯基, 2, 3, 3-三氯丙烯基和4, 4, 4-三氟丁-2-烯-1-基。在被卤素一、二或三取代的C₂-C₆链烯基中, 优选链长为3-5个碳原子。烷氧基基团优选链长为1-6碳原子。烷氧基例如是甲氧基, 乙氧基, 丙氧基, 异丙氧基, 正丁氧基, 异丁氧基, 仲丁氧基或叔丁氧基, 以及戊氧基和己氧基的异构体, 优选甲氧基和乙氧基。烷基羰基优选是乙酰基或丙酰基。烷氧羰基例如是甲氧基羰基, 乙氧基羰基, 丙氧基羰基, 异丙氧基羰基, 正丁氧基羰基, 异丁氧基羰基, 仲丁氧基羰基或叔丁氧基羰基; 优选甲氧基羰基或乙氧基羰基。烷硫基基团优选链长是1-4碳原子。烷硫基例如是甲硫基, 乙硫基, 丙硫基, 异丙硫基, 正丁硫基, 异丁硫基, 仲丁硫基或叔丁硫基, 优选甲硫基或乙硫基。烷基亚磺酰基例如是甲基亚磺酰

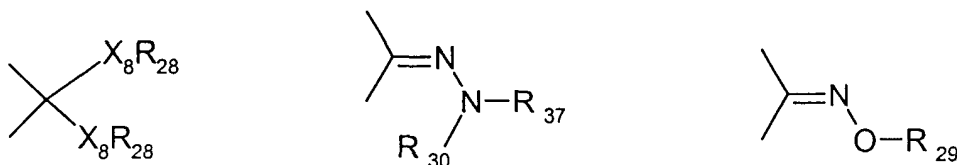
基, 乙基亚磺酰基, 丙基亚磺酰基, 异丙基亚磺酰基, 正丁基亚磺酰基, 异丁基亚磺酰基, 仲丁基亚磺酰基或叔丁基亚磺酰基; 优选甲基亚磺酰基或乙基亚磺酰基。烷基磺酰基例如是甲基磺酰基, 乙基磺酰基, 丙基磺酰基, 异丙基磺酰基, 正丁基磺酰基, 异丁基磺酰基, 仲丁基磺酰基或叔丁基磺酰基; 优选甲基磺酰基或乙基磺酰基。烷基氨基例如是甲基氨基, 乙基氨基, 正丙基氨基, 异丙基氨基或丁胺异构体。二烷基氨基例如是二甲基氨基, 甲基乙基氨基, 二乙基氨基, 正丙基甲基氨基, 二丁氨基或二异丙氨基。烷氧基烷基基团优选具有1-6个碳原子。烷氧基烷基例如是甲氧基甲基, 甲氧基乙基, 乙氧基甲基, 乙氧基乙基, 正丙氧基甲基, 正丙氧基乙基, 异丙氧基甲基或异丙氧基乙基。烷硫基烷基例如是甲硫基甲基, 甲硫基乙基, 乙硫基甲基, 乙硫基乙基, 正丙硫基甲基, 正丙硫基乙基, 异丙硫基甲基, 异丙硫基乙基, 丁硫基甲基, 丁硫基乙基或丁硫基丁基。苯基可以是被取代的形式。取代基可以在邻、间和/或对位的位置上。优选取代基的位置在相对于与环连接的位置是邻或对位。

芳基例如是苯基或萘基。这些基团可被取代。在定义中没有特别说明的情况下, 苯基也可以作为取代基如苯基烷基的一部分, 苯基可被下述基团取代: 卤素, 硝基, 氰基, C_1-C_4 烷基, C_1-C_4 烷氧基, C_1-C_4 烷硫基, C_1-C_4 烷基亚磺酰基, C_1-C_4 烷基磺酰基, 羧基, C_1-C_4 烷氧羰基, 氨基, C_1-C_4 烷基氨基, C_1-C_4 二烷基氨基或 C_1-C_4 烷基羰基氨基。

杂芳基基团通常是优选含有1-3个杂原子, 如氮、硫和氧的芳族杂环。适当的杂环和杂芳族化合物的实例包括: 吡咯烷酮、哌啶、吡喃、二噁烷、氮杂环丁烷、氧杂环丁烷、吡啶、嘧啶、三嗪、噻唑、噻二唑、咪唑、噁唑、异噁唑以及吡嗪、呋喃、吗啉、哌嗪、吡唑、苯并噁唑、苯并噻唑、喹喔啉和喹啉。这些杂环和杂芳族化合物还可进一步被下述基团取代: 卤素, 烷基, 烷氧基, 卤代烷基, 卤代烷氧基, 硝基, 氰基, 硫烷基, 烷基氨基或苯基。

在本发明的保护范围内, 应当理解的是3-至7-元环基团是指环系, 除了在取代基Q的环上可能已经存在的杂原子以外, 在环系上除了碳原

子以外，还可含有一个或多个杂原子如氮、氧和/或硫。它们可以是饱和或不饱和的。例如在基团 Q_2 中可通过取代基 R_6 和 R_7 形成不饱和键。优选这种环系中含有5-7个环原子。3-至7-元环基团包括环烷基，例如环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基或环辛基，也可以是被取代的。适当的取代基包括卤素，羟基，硝基，氰基， C_1 - C_4 烷基羰基， C_1 - C_4 -烷氧羰基， C_1 - C_4 烷基， C_1 - C_4 卤代烷基，酮基， C_2 - C_4 链烯氧基亚氨基， C_1 - C_4 烷氧基， C_1 - C_4 烷氧基烷氧基， C_1 - C_4 烷硫基，或下述三个基团之一：



其中 X_8 是硫或氧， R_{28} 是 C_1 - C_4 烷氧基或两个 R_{28} 基团和与它们键合的 $-X_8-C-X_8$ 桥一起形成5-或6-元环，该环可被甲基、乙基、甲氧基或酮基取代，

R_{29} 是 C_1 - C_4 烷基， C_1 - C_4 卤代烷基， C_2 - C_4 链烯基或 C_2 - C_4 卤代链烯基，

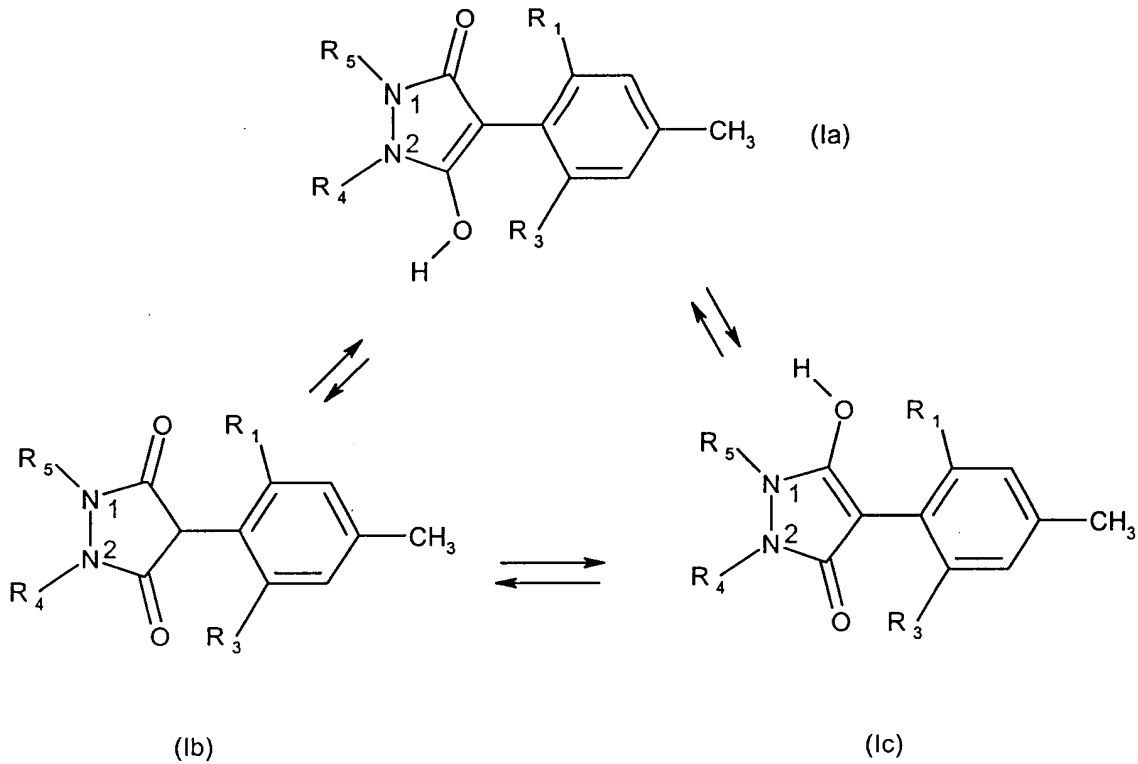
R_{30} 和 R_{37} 各自相互独立地是 C_1 - C_4 烷基，苯基或 C_2 - C_4 链烯基，或 R_{30} 和 R_{37} 与它们所键合的氮原子一起形成5-或6-元环，所述的环可含有选自氮、氧和硫的杂原子。

在取代基定义中，碳原子数目是烷基，链烯基和链炔基基团以及由它们衍生的基团例如卤代烷基或链烯氧基的碳原子总数。相应的， C_2 - C_3 烷氧基烷基包括甲氧基甲基、甲氧基乙基和乙氧基甲基。 C_3 烷氧羰基烷基包括甲氧羰基乙基和乙氧羰基甲基。

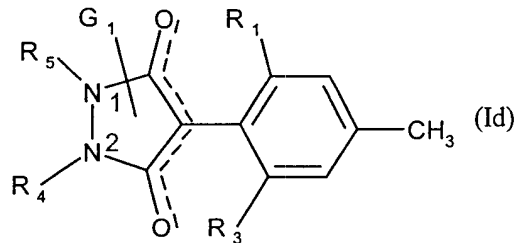
取代基 G_1 - G_{10} 中的碱金属、碱土金属或铵氧离子例如是钠、钾、镁、钙和铵的氧离子。优选的铯阳离子特别是三烷基铯阳离子，其中的烷基基团优选含有1-4个碳原子。

根据取代基的性质，式I化合物也可以是几何异构体和/或光学异构体和异构体混合物的形式，以及互变异构体和互变异构体混合物的形式。本发明还涉及式I的这些化合物，例如其中Q是 Q_1 和基团 G_1

是氢的式 I 化合物可以下述互变异构平衡存在:



当 G_1-G_{10} 不是氢以及 R_4 和 R_5 一起形成的环状基团是不对称取代、稠合或螺-键合, 例如式 I 化合物可以下述式 Id 的异构体形式存在:



本发明同样还包括式 I 化合物所能形成的盐, 优选与胺、碱金属、碱土金属碱或季铵碱形成的盐。适当的成盐物质已有描述, 例如 W098/41089 中所述。

本发明还包括式 I 化合物与胺、碱金属、碱土金属碱或季铵碱形成的盐。

在作为成盐物质碱金属和碱土金属氢氧化物之中, 值得注意的是锂、钠、钾、镁或钙的氢氧化物, 其中特别是钠或钾的氢氧化物。

适合用于形成铵盐的胺的实例包括氨或伯、仲和叔 C_1-C_{18} 烷基胺,

C₁-C₄羟基烷基胺和C₂-C₄-烷氧基烷基胺, 例如甲胺, 乙胺, 正丙胺, 异丙胺, 四种丁胺异构体, 正戊基胺, 异戊基胺, 己胺, 庚胺, 辛胺, 壬胺, 癸胺, 十五烷基胺, 十六烷基胺, 十七烷基胺, 十八烷基胺, 甲基-乙基胺, 甲基-异丙基胺, 甲基-己基胺, 甲基-壬基胺, 甲基-十五烷基胺, 甲基-十八烷基胺, 乙基-丁胺, 乙基-庚胺, 乙基-辛胺, 己基-庚胺, 己基-辛胺, 二甲胺, 二乙胺, 二正丙基胺, 二异丙胺, 二正丁基胺, 二正戊胺, 二异戊基胺, 二己基胺, 二庚基胺, 二辛基胺, 乙醇胺, 正丙醇胺, 异丙醇胺, N, N-二乙醇胺, N-乙基丙醇胺, 正丁基乙醇胺, 烯丙基胺, 正丁烯-2-胺, 正戊烯-2-胺, 2, 3-二甲基丁烯-2-胺, 二丁烯-2-胺, 正己烯-2-胺, 丙二胺, 三甲胺, 三乙胺, 三-正丙基胺, 三异丙基胺, 三-正丁基胺, 三异丁基胺, 三-仲丁基胺, 三-正戊基胺, 甲氧基乙基胺和乙氧基乙基胺; 杂环胺, 例如吡啶, 喹啉, 异喹啉, 吗啉, 哌啶, 吡咯烷, 二氢吲哚, 奎宁环和吡啶因; 伯芳基胺, 例如苯胺, 甲氧基苯胺, 乙氧基苯胺, 邻-, 间-和对-甲苯胺, 苯二胺, 联苯胺, 萘胺, 和邻-, 间-和对-氯苯胺, 特别是三乙胺, 异丙胺和二异丙胺。

适于形成相应盐的季铵碱例如是式[N(R_aR_bR_cR_d)]OH化合物, 其中R_a, R_b, R_c和R_d各自相互独立地是C₁-C₄烷基。也可以得到具有其它阴离子的其它适当的四烷基铵碱, 如阴离子交换反应。

在式I化合物中, 优选的是其中的Q是Q₁, Q₂, Q₃, Q₄, Q₅, Q₆, Q₇, Q₈或Q₉的化合物。

优选的式I化合物是其中R₄和R₅各自相互独立地是C₁-C₆烷基, C₁-C₆卤代烷基, C₂-C₆烷氧基烷基, C₄-C₈链烯氧基烷基, C₄-C₆链炔氧基烷基, C₂-C₆烷硫基烷基, C₂-C₆烷基亚磺酰基烷基, C₂-C₆烷基磺酰基烷基, C₂-C₆烷基羰基烷基, C₃-C₆-N-烷氧基-亚氨基烷基, C₃-C₆烷氧羰基烷基, C₁-C₆氨基-烷基, C₂-C₆二烷基氨基烷基, C₃-C₆烷基氨基烷基, C₁-C₆氰基烷基, C₄-C₈环烷基烷基, C₇-C₈苯基烷基, C₇-C₈杂芳基烷基, C₇-C₈苯氧基烷基, C₇-C₈杂芳氧基烷基, C₄-C₆-亚烷氨基氧基烷基, C₁-C₆硝基烷基, C₄-C₈三烷基甲硅烷基烷基, C₄-C₆烷基氨基羰基, C₃-C₆二烷基氨基羰基, C₄-C₈

烷基氨基羰氧烷基, C₄-C₈二烷基氨基羰氧烷基, C₄-C₈烷氧羰基氨基烷基, C₄-C₈-N-烷氧羰基-N-烷基氨基烷基, C₃-C₈环烷基, 芳基或杂芳基, 或

R₄和R₅与它们所键合的原子一起形成饱和或不饱和的5-至7-元环基团。

还优选的式I化合物是这些, 其中

R₂、R₆和R₃₂各自相互独立地是C₁-C₆烷基, C₁-C₆卤代烷基, C₂-C₆烷氧基-烷基, C₄-C₆链烯氧基烷基, C₄-C₆链炔氧基烷基, C₂-C₆烷硫基烷基, C₂-C₆烷基亚磺酰基烷基, C₂-C₆烷基磺酰基烷基, C₃-C₆烷基羰基烷基, C₃-C₈环烷基, 芳基或杂芳基;

R₇、R₃₁和R₃₃是氢, C₁-C₆烷基或C₁-C₆烷氧基烷基;

R₈是氢, C₁-C₆烷基, C₁-C₆卤代烷基, C₂-C₆烷氧基烷基, C₄-C₆链烯氧基烷基, C₄-C₆-链炔氧基烷基, C₁-C₆烷硫基烷基, C₁-C₆烷基亚磺酰基烷基, C₁-C₆烷基磺酰基烷基, C₃-C₈-环烷基, 芳基或杂芳基; 或

R₆和R₇或R₂和R₃₁或R₃₂和R₃₃与它们所键合的原子一起形成5-至7-元环基团, 该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子;

R₆和R₈与它们所键合的原子一起形成5-至7-元环基团, 该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子;

R₉、R₁₀、R₁₁和R₁₂各自相互独立地是C₁-C₆烷基, C₁-C₆卤代烷基, C₂-C₈-烷氧基烷基, C₄-C₆链烯氧基烷基, C₄-C₆链炔氧基烷基, C₂-C₆烷硫基烷基, C₂-C₆烷基亚磺酰基烷基, C₂-C₆烷基磺酰基烷基, C₃-C₆烷基羰基烷基, C₃-C₈环烷基, 芳基或杂芳基; 或

R₉和R₁₁或R₉和R₁₀与它们所键合的原子一起形成5-至7-元环基团, 该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子;

R₉和R₁₀与它们所键合的原子一起形成饱和的3-至7-元环基团, 该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子;

R₁₃、R₁₄、R₃₄和R₃₅各自相互独立地是C₁-C₆烷基, C₁-C₆卤代烷基, C₂-C₆-烷氧基烷基, C₄-C₆链烯氧基烷基, C₄-C₆链炔氧基烷基, C₂-C₆烷硫基烷基, C₂-C₆烷基亚磺酰基烷基, C₂-C₆烷基磺酰基烷基, C₃-C₈烷基

羰基烷基, C_3-C_8 环烷基, 芳基或杂芳基; 或

R_{13} 和 R_{14} 或 R_{34} 和 R_{35} 与它们所键合的原子一起形成5-至7-元环基团, 该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子;

R_{15} 是 C_1-C_6 烷基, C_1-C_6 卤代烷基, C_2-C_8 烷氧基烷基, C_4-C_6 链烯氧基烷基, C_4-C_8 链炔氧基烷基, C_2-C_6 烷硫基烷基, C_2-C_6 烷基亚磺酰基烷基, C_2-C_6 烷基磺酰基烷基, C_3-C_6 烷基羰基烷基, C_3-C_6 烷氧羰基烷基, C_2-C_6 氨基烷基, C_4-C_6 二烷基氨基烷基, C_4-C_6 烷基氨基烷基, C_2-C_6 氰基烷基, C_3-C_8 环烷基烷基, C_7-C_8 苯基烷基, C_7-C_8 杂芳基烷基, C_7-C_8 -苯氧基烷基, C_6-C_8 杂芳氧基烷基, C_1-C_6 硝基烷基, C_3-C_8 环烷基, 芳基或杂芳基;

R_{16} 是 C_1-C_6 烷基, C_1-C_6 卤代烷基, C_2-C_6 烷氧基烷基, C_4-C_6 链烯氧基烷基, C_4-C_6 链炔氧基烷基, C_2-C_6 烷硫基烷基, C_2-C_6 烷基亚磺酰基烷基, C_2-C_6 烷基磺酰基烷基, C_3-C_8 环烷基, 芳基或杂芳基;

R_{17} 是 C_1-C_6 烷基, C_1-C_6 卤代烷基, C_2-C_6 烷氧基烷基, C_4-C_6 链烯氧基烷基, C_4-C_6 链炔氧基烷基, C_2-C_8 烷硫基烷基, C_2-C_6 烷基亚磺酰基烷基, C_2-C_6 烷基磺酰基烷基, C_3-C_6 烷基羰基烷基, C_3-C_8 环烷基, 芳基或杂芳基;

R_{18} 是氢, C_1-C_6 烷基或 C_2-C_6 烷氧基烷基; 或

R_{17} 和 R_{18} 与它们所键合的原子一起形成3-至7-元环基团, 该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子;

R_{19} 和 R_{36} 各自相互独立地是 C_1-C_6 烷基, C_1-C_6 卤代烷基, 苯基或杂芳基; 或

R_{18} 和 R_{19} 或 R_{18} 和 R_{36} 与它们所键合的原子一起形成饱和的5-至7-元环基团, 该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子;

R_{20} 、 R_{21} 、 R_{22} 、 R_{23} 和 R_{27} 各自相互独立地是氢, C_1-C_8 烷基, C_1-C_8 -卤代烷基, C_1-C_8 氰基烷基, C_1-C_8 硝基烷基, C_1-C_8 氨基烷基, C_1-C_5 烷基氨基- C_1-C_2 烷基, C_2-C_6 二烷基氨基- C_1-C_2 烷基, C_3-C_7 环烷基- C_1-C_2 烷基, C_2-C_8 烷氧基烷基, C_4-C_8 链烯氧基-烷基, C_4-C_8 链炔氧基烷基, C_2-C_8 烷硫基烷基, C_1-C_2 烷基亚磺酰基- C_1-C_2 烷基, C_1-C_2 烷基-磺酰基- C_1-C_2 烷基, C_2-C_8 亚烷氨基氧基- C_1-C_2 烷基, C_1-C_5 烷基羰基- C_1-C_2 烷基, C_1-C_5 烷氧羰基

-C₁-C₂烷基, C₁-C₅氨基-羰基-C₁-C₂烷基, C₂-C₈二烷基氨基-羰基-C₁-C₂烷基, C₁-C₅烷基羰基氨基-C₁-C₂烷基, C₁-C₂烷基羰基-N-C₁-C₃烷基-C₁-C₂氨基烷基, C₃-C₆-三烷基甲硅烷基-C₁-C₃烷基, 苯基-C₁-C₂烷基, 杂芳基-C₁-C₂烷基, 苯氧基-C₁-C₂烷基, 杂芳氧基-C₁-C₂烷基、C₂-C₅链烯基, C₂-C₅卤代链烯基, C₃-C₈环烷基, 苯基或杂芳基;

R₂₄、R₂₅和R₂₆各自相互独立地是氢, C₁-C₈烷基, C₁-C₈卤代烷基, C₁-C₈氰基烷基, C₁-C₈硝基烷基, C₁-C₈氨基烷基, C₁-C₅烷基氨基-C₁-C₂烷基, C₂-C₆二烷基氨基-C₁-C₂烷基, C₃-C₇环烷基-C₁-C₂烷基, C₂-C₈烷氧基烷基, C₄-C₈链烯氧基烷基, C₄-C₈-链炔氧基烷基, C₂-C₈烷硫基烷基, C₁-C₂烷基亚磺酰基-C₁-C₂烷基, C₁-C₂烷基磺酰基-C₁-C₂烷基, C₂-C₈亚烷基氨基氧基-C₁-C₂烷基, C₁-C₅烷基羰基-C₁-C₂烷基, C₁-C₅烷氧基-羰基-C₁-C₂烷基, C₁-C₅氨基-羰基-C₁-C₂烷基, C₂-C₈二烷基氨基-羰基-C₁-C₂烷基, C₁-C₅烷基羰基氨基-C₁-C₂烷基, C₁-C₂烷基羰基-N-C₁-C₃烷基-C₁-C₂氨基烷基, C₃-C₈三烷基甲硅烷基-C₁-C₃烷基, 苯基-C₁-C₂烷基, 杂芳基-C₁-C₂烷基, 苯氧基-C₁-C₂烷基, 杂芳氧基-C₁-C₂烷基, C₂-C₅链烯基, C₂-C₅卤代链烯基, C₃-C₈环烷基, 苯基, 杂芳基, C₁-C₆烷氧基, C₁-C₈卤代烷氧基, C₁-C₃烷基氨基, C₂-C₆二烷基氨基, 或苄氧基或苯氧基, 其中的苄基和苯基又可被下述基团取代: C₁-C₃烷基、C₁-C₃卤代烷基、C₁-C₃烷氧基、C₁-C₃卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基; 和

R₂₇是C₁-C₈烷基, C₁-C₈卤代烷基, C₁-C₈氰基烷基, C₁-C₈硝基烷基, C₁-C₈氨基烷基, C₁-C₅-烷基氨基-C₁-C₂烷基, C₂-C₆二烷基氨基-C₁-C₂烷基, C₃-C₇环烷基-C₁-C₂烷基, C₂-C₈-烷氧基烷基, C₄-C₈链烯氧基烷基, C₄-C₈链炔氧基烷基, C₂-C₈烷硫基烷基, C₁-C₂烷基亚磺酰基-C₁-C₂烷基, C₁-C₂烷基磺酰基-C₁-C₂烷基、C₂-C₈亚烷基氨基氧基-C₁-C₂烷基, C₁-C₅烷基羰基-C₁-C₂烷基, C₁-C₅烷氧基羰基-C₁-C₂烷基, C₁-C₅氨基-羰基-C₁-C₂-烷基, C₂-C₈二烷基氨基羰基-C₁-C₂烷基, C₁-C₅烷基羰基氨基-C₁-C₂烷基, C₁-C₂-烷基羰基-N-C₁-C₃烷基-C₁-C₂氨基烷基, C₃-C₆三烷基甲硅烷基-C₁-C₃烷基, 苯基-C₁-C₂烷基, 杂芳基-C₁-C₂烷基, 苯氧基-C₁-C₂烷基, 杂芳氧基-C₁-C₂烷基, C₂-C₅链烯基, C₂-C₅-卤代链烯基, C₃-C₈环烷基, 苯基, 杂

芳基, C_1-C_6 烷氧基, C_1-C_6 卤代烷氧基, C_1-C_8 -烷基羰基, C_1-C_3 烷基氨基, C_2-C_6 二烷基氨基, 或苜氧基或苯氧基, 其中的苜基和苯基又可被下述基团取代: C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基。

特别优选的式I化合物是下述的化合物, 其中,

R_1 和 R_3 各自相互独立地是乙基, 卤代乙基, 乙炔基, C_1-C_2 烷氧基, C_1-C_2 -卤代烷氧基或 C_1-C_2 烷基羰基;

R_4 和 R_5 各自相互独立地是 C_1-C_6 烷基, C_1-C_8 卤代烷基, C_2-C_6 烷氧基烷基, C_2-C_6 烷基羰基烷基, C_3-C_6 烷氧羰基烷基, C_1-C_8 氨基烷基, C_2-C_6 二烷基氨基烷基, C_3-C_6 烷基氨基烷基, C_1-C_6 氰基烷基, C_3-C_8 环烷基, 芳基或杂芳基; 或

R_4 和 R_5 与它们所键合的原子一起形成5-至7-元环基团, 该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子;

R_2 、 R_6 和 R_{32} 各自相互独立地是 C_1-C_6 烷基, C_1-C_6 卤代烷基, C_2-C_6 烷氧基烷基, C_3-C_8 环烷基, 芳基或杂芳基;

R_7 、 R_{31} 和 R_{33} 各自相互独立地是氢, C_1-C_6 烷基或 C_1-C_6 烷氧基烷基;

R_8 是氢, C_1-C_6 烷基, C_1-C_6 卤代烷基, C_2-C_6 烷氧基烷基, C_1-C_6 烷硫基烷基, C_3-C_8 环烷基, 芳基或杂芳基; 或

R_6 和 R_7 或 R_2 和 R_{31} 或 R_{32} 和 R_{33} 与它们所键合的原子一起形成饱和的3-至7-元环基团, 该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子; 或

R_6 和 R_8 与它们所键合的原子一起形成5-至7-元环基团, 该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子;

R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 和 R_{12} 各自相互独立地是 C_1-C_6 烷基, C_1-C_8 卤代烷基, C_2-C_6 -烷氧基烷基, C_3-C_8 环烷基, 芳基或杂芳基; 或

R_9 和 R_{11} 与它们所键合的原子一起形成5-至7-元环基团, 该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子;

R_9 和 R_{10} 与它们所键合的原子一起形成饱和的3-至7-元环基团, 该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子;

R_{13} 、 R_{14} 、 R_{34} 和 R_{35} 各自相互独立地是 C_1-C_6 烷基, C_3-C_8 环烷基, 芳基

或杂芳基；或

R_{13} 和 R_{14} 或 R_{34} 和 R_{35} 与它们所键合的原子一起形成5-至7-元环基团，该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子；

R_{15} 是 C_1 - C_8 烷基， C_1 - C_6 卤代烷基， C_2 - C_8 烷氧基烷基， C_4 - C_6 链烯氧基烷基， C_2 - C_6 烷硫基烷基， C_2 - C_6 烷基亚磺酰基烷基， C_3 - C_8 烷氧羰基烷基， C_3 - C_8 环烷基，芳基或杂芳基；

R_{16} 是 C_1 - C_6 烷基， C_1 - C_6 卤代烷基， C_2 - C_6 烷氧基烷基， C_3 - C_8 环烷基，芳基或杂芳基；

R_{17} 是 C_1 - C_6 烷基， C_1 - C_6 卤代烷基， C_3 - C_8 环烷基，芳基或杂芳基；

R_{18} 是氢， C_1 - C_6 烷基或 C_2 - C_6 烷氧基烷基；或

R_{17} 和 R_{18} 与它们所键合的原子一起形成3-至7-元环基团，该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子；

R_{19} 和 R_{36} 各自相互独立地是 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_6 卤代烷基；或

R_{18} 和 R_{19} 或 R_{18} 和 R_{36} 与它们所键合的原子一起形成饱和的5-至7-元环基团，该环可含有一个或二个选自氮、氧和硫的杂原子；

R_{20} 、 R_{21} 、 R_{22} 和 R_{23} 是各自相互独立地是氢， C_1 - C_8 烷基， C_1 - C_8 卤代烷基， C_3 - C_7 环烷基- C_1 - C_2 烷基， C_2 - C_8 烷氧基烷基，苯基- C_1 - C_2 烷基，杂芳基- C_1 - C_2 烷基，苯氧基- C_1 - C_2 烷基，杂芳氧基- C_1 - C_2 烷基， C_2 - C_5 链烯基， C_2 - C_5 卤代链烯基， C_3 - C_8 环烷基，苯基或杂芳基；

R_{24} 、 R_{25} 和 R_{26} 是各自相互独立地是氢， C_1 - C_8 烷基， C_1 - C_8 卤代烷基， C_3 - C_7 环烷基- C_1 - C_2 烷基， C_2 - C_8 烷氧基烷基，苯基- C_1 - C_2 烷基，杂芳基- C_1 - C_2 烷基，苯氧基- C_1 - C_2 烷基，杂芳氧基- C_1 - C_2 烷基， C_2 - C_5 链烯基， C_2 - C_5 卤代链烯基， C_3 - C_8 环烷基，苯基，杂芳基， C_1 - C_6 烷氧基， C_1 - C_3 烷基氨基或 C_2 - C_6 二烷基氨基；和

R_{27} 是 C_1 - C_8 烷基， C_1 - C_8 卤代烷基， C_3 - C_7 环烷基- C_1 - C_2 烷基， C_2 - C_8 烷氧基烷基，苯基- C_1 - C_2 -烷基，杂芳基- C_1 - C_2 烷基，苯氧基- C_1 - C_2 烷基，杂芳氧基- C_1 - C_2 烷基， C_2 - C_5 链烯基， C_2 - C_5 卤代链烯基， C_3 - C_8 环烷基，苯基，杂芳基， C_1 - C_6 烷氧基， C_1 - C_3 烷基氨基， C_2 - C_6 -二烷基氨基或 C_1 - C_8 烷基羰基。

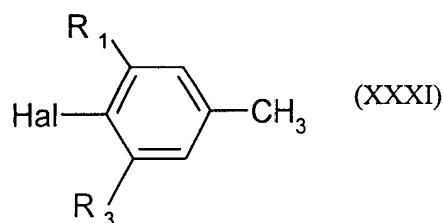
式 I 化合物可用下述方法制备:

使下述式 XXX 化合物:



其中Q是 $Q_1, Q_2, Q_3, Q_4, Q_5, Q_6, Q_7, Q_8, Q_9$ 或 Q_{10} , 其取代基除 $G_1, G_2, G_3, G_4, G_5, G_6, G_7, G_8, G_9$ 和 G_{10} 以外, 具有上述定义, 并且 $G_1, G_2, G_3, G_4, G_5, G_6, G_7, G_8, G_9$ 和 G_{10} 是氢,

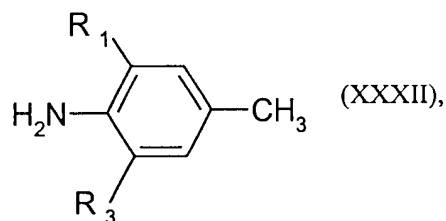
与下述式XXXI化合物进行反应:



其中 R_1 和 R_3 如式I中所定义, Hal是氯、溴或碘, 反应在惰性溶剂、碱和钯催化剂存在下, 于30至250°C进行。该反应优选在惰性气体气氛中进行。

出人意料的是, 该方法对于制备其中的 R_1 和 R_3 是乙基的式I化合物是特别有利的。用于制备式I化合物、其中的 R_1 和 R_3 是乙基并且Hal是氯、溴或碘的式XXXI中间体(式XXXIa)是新的, 并且是为了该方法而特别开发的。因此, 本发明还涉及这些中间体。

式XXX化合物是已知的, 或可按照已知的方法制备, 例如可按照J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1(1987), (4), 877-884中所述的方法制备。式XXXI化合物可按照已知的方法制备, 例如经由重氮盐制备, 例如通过Sandmeyer反应以式XXXII相应的苯胺为原料制备:



其中 R_1 和 R_3 如式I中所定义。这些反应例如描述在《Vogel实用有机化学教材》Vogel's Textbook of Practical Organic Chemistry, 第5版,

B. S. Furniss, A. J. Hannaford, P. W. G. Smith, A. R. Tatchell; Longman Scientific & Technical 1989, 第923页。式XXXII化合物是已知的; 其中有一些可以买到, 或可按照与已知方法类似的方法制备。

适当的反应用碱例如是磷酸的三碱金属盐、碱金属和碱土金属的氯化物、碱金属和碱土金属的氯化物或碱金属醇盐, 例如磷酸三钾、氯化钠、二异丙基氯化锂(LDA)、叔丁醇钠或叔丁醇钾。叔丁醇钠、叔丁醇钾和磷酸三钾是特别优选的。

适当的溶剂包括例如芳烃如二甲苯或甲苯, 醚如四氢呋喃、二噁烷或乙二醇二甲醚, 二甲亚砜, 或叔酰胺如二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮或二甲基乙酰胺, 以及非环脲如N,N'-二甲基亚丙基脲。

考虑用于式XXX化合物与式XXXI化合物C-C偶合反应的钯催化剂通常是钯(II)或钯(0)的配合物, 例如二卤化钯(II)、乙酸钯(II)、硫酸钯(II)、二(三苯膦)氯化钯(II)、二(三环戊基膦)氯化钯(II)、二(三环己基膦)氯化钯(II)、二(二亚苺基丙酮)合钯(0)或四(三苯基膦)合钯(0)。钯催化剂也可由钯(II)或钯(0)化合物现场制备, 该制备是通过与所需的配位体复合来完成, 例如, 使欲配位的钯(II)盐如氯化钯(II) (PdCl_2) 或乙酸钯(II) ($\text{Pd}(\text{OAc})_2$) 与所需的配位体如三苯基膦(PPh_3)、三环戊基膦或三环己基膦与所选择的溶剂, 以及式XXXI化合物、式XXX化合物和碱相结合。适当的配位体是二齿配位体如1,1'-二(二苯基膦)二茂铁或1,2-二(二苯基膦)乙烷。加热反应介质, C-C偶合反应所需的钯(II)复合物或钯(0)复合物就可在现场制得, 然后开始C-C偶合反应。以式XXXI化合物为基础, 所用钯催化剂的量为0.001至50mol%, 优选0.1—15mol%。

按照所用溶剂, 以及如果合适的话, 还有压力选择反应温度。优选在大气压下进行。

其中的Q是Q₁的式I化合物可按照与WO 96/21652所述类似的方法制备。其中的Q是Q₂的式I化合物可按照例如EP-A-0 415 185, EP-A-0 521 334, EP-A-0 355 599和 EP-A-0 442 077所述方法制备。其中的Q是Q₃, Q₄, Q₆或Q₇的式I化合物例如可按照WO 96/35644 和WO 97/02243所述的

方法制备。其中的Q是Q₅的式I化合物例如可按照与WO 97/14667所述类似的方法制备。制备其中Q是Q₇的式I化合物的类似方法如WO 97/16436所述。其中Q是Q₈的式I化合物可按照与US-A-5 994 274所述类似的方法制备。其中的Q是Q₉的式I化合物可按照与JP 11152273 A (优先权: 1997.11.19, JP318614)所述类似的方法制备, 其中Q是Q₁₀的式I化合物可按照 J. Org. Chem. (1979), 44(26), 4906-4912或 J. Org. Chem. (1977), 42(7), 1163-1169所述的方法或与其类似的方法制备。

制备式I化合物的反应在非质子惰性有机溶剂中进行是有利的。这些溶剂是烃类如苯、甲苯、二甲苯或环己烷, 氯代烃如二氯甲烷、三氯甲烷、四氯甲烷或氯苯, 醚类如乙醚、乙二醇二甲醚、二乙二醇二甲醚、四氢呋喃或二噁烷, 腈类如乙腈或丙腈, 和酰胺如N,N-二甲基甲酰胺、二乙基甲酰胺或N-甲基吡咯烷酮。优选反应温度为-20°C至+120°C。反应通常略有放热, 并通常在室温下进行。为了缩短反应时间, 或为了开始反应, 需要时可在短时间内将温度提高到反应混合物的沸点。通过加入几滴碱作为反应催化剂, 可缩短反应时间。适当的碱尤其包括叔胺, 如三甲胺、三乙胺、奎宁环、1,4-二氮杂双环[2.2.2]辛烷、1,5-二氮杂双环[4.3.0]壬-5-烯和1,5-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯, 但是也可以使用无机碱, 例如氢化物如氢化钠或氢化钙, 氢氧化物如氢氧化钠或氢氧化钾, 碳酸盐如碳酸钾或碳酸钠, 或碳酸氢盐如碳酸氢钾或钠。

式I化合物可采用浓缩和/或蒸发溶剂的常规手段分离, 将固体残余物在其不易溶的溶剂中进行重结晶或研磨以进行纯化, 这些溶剂例如乙醚、芳烃或氯代烃。

对本发明式I化合物或含有该化合物的组合物的应用而言, 可以任何适当的方式应用于农业, 例如芽前应用、芽后应用和拌种, 并可使用各种方法和技术, 如活性成分的控制释放。在此方法中, 将活性成分以溶液的形式应用于无机颗粒载体或聚合的颗粒物(脲/甲醛), 并干燥。适当的, 也可以使用包衣(包覆的颗粒剂), 以使活性成分在特定的时间内定量释放。

式I化合物可以未改性的方式，即以合成中得到的化合物，直接用作除草剂。但优选用常规方法，使用剂型技术中常规的辅剂加工成例如乳油、直可喷雾的或可稀释的溶液、稀乳剂、可湿性粉剂、可溶性粉剂、粉剂、颗粒剂或微胶囊。这些制剂例如如W0 97/34485 的第9-13页所述。根据所预期的目的和主要的环境选择组合物的性质、施用的方法如喷雾、弥雾、喷粉、湿润、撒施或浇淋。

剂型加工物 (formulations)，即组合物、制剂或混合物含有式I的活性成分，或含有至少一种式I化合物的活性成分，并通常含有一种或多种固体或液体的剂型助剂，可用本领域已知的方法在制备，例如使活性成分与剂型助剂一起充分混合和/或研磨，这些辅剂例如是溶剂或固体载体。此外，也可将表面活性化合物（表面活性剂）用于该剂型的制备。溶剂和固体载体的实例例如如W0 97/34485，第6页所述。

根据式I活性成分的性质，适当的表面活性化合物是具有良好的乳化、分散和湿润性能的非离子、阳离子和/或阴离子表面活性剂。适当的阴离子、非离子和阳离子表面活性剂例如如W0 97/34485的第7和8页所述。另外，适合于用于制备本发明除草组合物的表面活性剂是剂型技术中常用的表面活性剂，如在“《Mc Cutcheon洗涤剂 and 乳化剂年报》Mc Cutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual”，MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey, 1981; Stache, H., “Tensid-Taschenbuch”, Carl Hanser Verlag, MunichVienna, 1981以及M.和J. Ash, “《表面活性剂大全》Encyclopedia of Surfactants”，第I-III卷，Chemical Publishing Co., New York, 1980-81中所述。

本发明含有有效量的式I化合物的除草和抑制植物生长的组合物的活性可通过加入喷雾罐混助剂而提高。这些助剂例如可以是非离子表面活性剂，非离子表面活性剂的混合物，阴离子表面活性剂与非离子表面活性剂的混合物，阳离子表面活性剂，有机硅表面活性剂，有或没有表面活性剂的矿物油衍生物，有或没有加入表面活性剂的植物油衍生物，植物油或矿物油的烷基化衍生物，有或没有表面活性剂的鱼油或其它动物油性质的动物油及其烷基化衍生物，优选具有8-28个

碳原子的天然存在的高级脂肪酸及其烷基酯衍生物，含有芳环体系和一个或多个羧酸酯的有机酸，及其烷基衍生物，以及乙酸乙烯酯聚合物或乙酸乙烯酯/丙烯酸酯的共聚物的悬浮液，单个助剂相互之间的混合物，以及与有机溶剂的结合可导致活性进一步提高。

适当的非离子表面活性剂例如包括脂族或环脂族醇，饱和或不饱和脂肪酸以及烷基酚的聚二元醇醚的衍生物，优选可含有 3-30 二元醇醚基团和在（脂族）烃基团中含有 8 - 20 个碳原子，以及在烷基酚的烷基基团中含有 6 - 18 个碳原子。

进一步的，适当的非离子表面活性剂是水溶性的聚丙二醇、亚乙基二氨基聚丙二醇和烷基聚丙二醇的聚氧化乙烯的加成物，其中优选在烷基链中具有 1-10 个碳原子，该加成物优选含有 20-250 个乙二醇醚基团，和 10-100 丙二醇醚基团。所述的化合物通常是每个丙二醇单元含有 1-5 个乙二醇单元。

作为非离子表面活性剂进一步的实例，还可以提及的是壬基苯酚聚乙氧基乙醇、蓖麻油聚二元醇醚、聚环氧丙烷/聚环氧乙烷加成物、三丁基苯氧基聚乙氧基乙醇、聚乙二醇和辛基苯氧基聚乙氧基乙醇。

聚氧乙烯脱水山梨糖醇的脂肪酸酯如聚氧乙烯脱水山梨糖醇三油酸酯也是适用的。

优选的非离子表面活性剂特别是烷基硫酸盐、烷基磺酸盐、烷基芳基磺酸盐、烷基化的磷酸，和其乙氧基化的衍生物。其中的烷基基团通常含有 8-24 个碳原子。

优选的非离子表面活性剂已知有下述商品名称：

聚氧乙烯椰油烷基胺（如 AMIET[®] 105 (Kao Co.)），聚氧乙烯油基胺（如 AMIET[®] 415 (Kao Co.)），壬基苯酚聚乙氧基乙醇，聚氧乙烯硬脂基胺（AMIET[®] 320 (Kao Co.)），N-聚乙氧基乙胺（GENAMIN[®] (Hoechst AG)），N,N,N',N'-四（聚乙氧基聚丙氧基乙基）亚乙基二胺（如 TERRONIL[®] 和 TETRONIC[®] (BASF Wyandotte Corp.)），BRIJ[®] (Atlas Chemicals)，ETHYLAN[®] CD 和 ETHYLAN[®] D (Diamond Shamrock)，GENAPOL[®] C，GENAPOL[®] O，GENAPOL[®] S 和 GENAPOL[®] X080 (Hoechst AG)，EMULGEN[®]

104P, EMULGEN[®] 109P 和 EMULGEN[®] 408(Kao Co.); DISTY[®] 125 (Geronazzo), SOPROPHOR[®] CY 18 (Rhone Poulenc S.A.); NONISOL[®] (Ciba-Geigy), MRYJ[®] (ICI); TWEEN[®] (ICI); EMULSOGEN[®] (Hoechst AG); AMIDOX[®] (Stephan Chemical Co.), ETHOMID[®] (Armak Co.); PLURONIC[®] (BASF Wyandotte Corp.), SOPROPHOR[®] 461 P (Rhône Poulenc S.A.), SOPROPHOR[®] 496/P (Rhone Poulenc S.A.), ANTAROX FM-63 (Rhone Poulenc S.A.), SLYGARD 309 (Dow Corning), SILWET 408, SILWET L-7607N (Osi-Specialities).

阳离子表面活性剂特别是作为N-取代基至少有一个烷基基团具有8-22个碳原子的季铵盐, 作为其它的取代基, 可以是卤代低级烷基、苄基或羟基-低级烷基基团。盐优选是卤化物、甲基硫酸盐或乙基硫酸盐的形式, 例如硬脂基三甲基铵氯化物或苄基二(2-氯乙基)乙基铵溴化物。

所用的油可以是矿物油或天然来源的油。天然油又可以是动物或植物来源的。动物油中优选是牛油衍生物, 但也可以使用鱼油(如沙丁鱼油)和其衍生物。植物油大部分是各种来源的种子的油。所用植物油的实例特别可提及的是椰子油、菜籽油和葵花籽油和其衍生物。

在本发明的组合物中, 以喷雾混合物为基础, 油添加剂的浓度通常是0.01-2%。例如在制得喷雾混合物之后, 以所需的浓度向喷雾罐中加入油添加剂。

本发明组合物中, 优选的油添加剂包括植物来源的油, 例如菜籽油或葵花籽油, 植物来源的油的烷基酯如甲基衍生物, 或矿物油。

特别优选的油添加剂包括高级脂肪酸(C₈-C₂₂)的烷基酯, 特别是C₁₂-C₁₈脂肪酸的甲基衍生物, 例如月桂酸、棕榈酸和油酸的甲基酯。这些酯已知是月桂酸甲酯(CAS-111-82-0)、棕榈酸甲酯(CAS-112-39-0)和油酸甲酯(CAS-112-62-9)。

通过将油添加剂与表面活性物质结合使用可改进它们的施用和作用, 所述的表面活性物质例如是非离子表面活性剂、阴离子或阳离子表面活性剂。适当的阴离子、非离子或阳离子表面活性剂的例子列于

WO 97/34485的第7和8页。

优选的表面活性物质是十二烷基苄基磺酸盐类的阴离子表面活性剂，特别是其钙盐，和脂肪醇乙氧基化物类的非离子表面活性剂。特别优选的是乙氧基化的C₁₂-C₂₂脂肪醇，其乙氧基化度为5 - 40。可以买到的优选表面活性剂的例子是Genapol类(Clariant AG, Muttenz, Switzerland)。

相对于添加剂总量而言，表面活性物质的浓度通常是1-30重量%。

与表面活性剂一起组成油或矿物油或其衍生物的混合物的油添加剂的实例包括 Edenor ME SU[®]， Emery 2231[®] (Henkel subsidiary Cognis GMBH, DE)， Turbocharge[®] (Zeneca Agro, Stoney Creek, Ontario, CA)， 或更特别的是 Actipron[®] (BP Oil UK Limited, GB)。

在油添加剂 / 表面活性剂混合物中加入有机溶剂有可能进一步提高其活性。适当的溶剂例如包括 Solvesso[®] (ESSO) 和 Aromatic Solvent[®] (Exxon Corporation) 类的溶剂。

这些溶剂的浓度相对于总重量而言，可以是10-80重量%。

在US-A-4834908中所述的这类油添加剂，对本发明组合物来是特别优选的。更优选的油添加剂是已知其商品名称为MERGE[®]的商品，可由BASF公司得到，在US-A-4834 908，第5栏，实施例COC-1中已有基本的描述。本发明中优选的其它油添加剂是SCORE[®] (Novartis Crop Protection Canada)。

在剂型和助剂技术中通常所使用的表面活性剂、油，特别是植物油、其衍生物如烷基化的脂肪酸和其混合物，例如优选与阴离子表面活性剂如烷基化的磷酸、烷基硫酸盐和烷基芳基磺酸盐以及还有高级脂肪酸的混合物，在本发明组合物中以及在喷雾剂罐溶液中也使用，这些尤其在下述文献中已有描述：“《Mc Cutcheon 洗涤剂 and 乳化剂年报》Mc Cutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual” MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey, 1998; Stache, H., “Tensid-Taschenbuch”, Carl Hanser Verlag, MunichNienna, 1990; M. 和 J. Ash, “《表面活性剂大全》Encyclopedia of Surfactants”,

第 1-IV 卷, Chemical Publishing Co., New York, 1981-89; G. Kapusta, “《除草剂助剂简编》A Compendium of Herbicide Adjuvants”, Southern Illinois Univ., 1998; L. Thomson Harvey, “《美国农业喷雾助剂指南》A Guide to Agricultural Spray Adjuvants Used in the United States”, Thomson Pubns., 1992.

除草制剂通常含有 0.1-99 重量%，特别是 0.1-95 重量%的除草剂，1-99.9%，特别是 5-99.8 重量%的固体或液体制剂助剂，以及 0-25 重量%，特别是 0.1-25 重量%的表面活性剂。作为商品优选加工成为浓缩剂，终端用户通常可使用稀释制剂。组合物还可包括其它组份如稳定剂如植物油或环氧化的植物油(环氧化的椰子油、菜籽油或大豆油)，消泡剂如硅油、防腐剂、粘度调节剂、粘合剂、增粘剂和肥料或其它活性成分。

在植物或其场所，所用的式 I 活性成分的施用量通常是 0.001-4 kg/ha，特别是 0.005-2 kg/ha。要达到所需效果所需要的浓度可通过试验确定。它取决于作用的类型、作物植物和杂草的生长阶段和施用情况(位置、时间、方法)，并且依据这些因素，可在很宽的范围内变化。

式 I 化合物具有卓越的除草和抑制植物生长的性能，使其适于应用于有用的作物，特别是用于禾谷类、棉花、大豆、甜菜、甘蔗、栽培作物、油菜、玉米和稻，以及非选择性地防治杂草。应当理解的是，作物包括用常规培育方法或遗传工程方法培育的，对除草剂或各类除草剂有耐受性的那些作物，例如包括 IMI Maize, Poast Protected Maize(耐受稀禾定), Liberty Link Maize, B. t. /Liberty Link Maize, IMI/Liberty Link Maize, IMI/Liberty Link/B. t. Maize, Roundup Ready Maize and Roundup Ready/B. t. Maize.

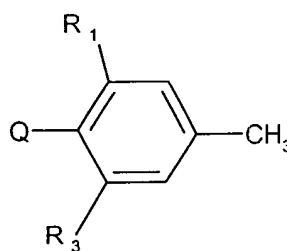
欲防治的杂草可以是单子叶或双子叶杂草，例如繁缕属 (*Stellaria*)，豆瓣菜属 (*Nasturtium*)，剪股颖属 (*Agrostis*)，马唐属 (*Digitaria*)，燕麦属 (*Avena*)，狗尾草属 (*Setaria*)，白芥属 (*Sinapis*)，黑麦草属 (*Lolium*)，茄属 (*Solanum*)，稗属 (*Echinochloa*)，蔗草属

(Scirpus), 雨久花属 (Monochoria), 慈菇属 (Sagittaria), 雀麦属 (Bromus), 看麦娘属 (Alopecurus), 石茅 (Sorghum halepense), 筒轴茅属 (Rottboellia), 莎草属 (Cyperus), 苘麻属 (Abutilon), 黄花稔属 (Sida), 苍耳属 (Xanthium), 苋属 (Amaranthus), 藜属 (Chenopodium), 番薯属 (Ipomoea), 茼蒿属 (Chrysanthemum), 猪殃殃属 (Galium), 堇菜属 (Viola) 和婆婆纳属 (Veronica)。

令人惊讶的是, 在US-A-5041157, US-A-5541148, US-A-5006656, EP-A-0 094 349, EP-A-0 551 650, EP-A-0 268 554, EP-A-0 375 061, EP-A-0 174 562, EP-A-492 366, WO 91/7874, WO 94/987, DE-A-19612943, WO 96/29870, WO 98/13361, WO 98/39297, WO 98/27049, EP-A-0716073, EP-A-0 613 618, US-A-5 597 776, EP-A-0 430 004, DE-A-4 331 448, WO 99/16744, WO 00/30447和 WO 00/00020中给出的特定的安全剂也适用于与本发明的除草组合物进行混合。因此, 本发明还涉及用于防治禾本科杂草和有用作物中的杂草, 特别是在玉米和谷类作物中的杂草的选择性除草组合物, 这些组合物含有式I的除草剂和安全剂(解毒剂), 保护有用的植物, 而不是杂草免受除草剂的植物毒性作用, 本发明还涉及这些组合物在有用作物中防治杂草的应用。

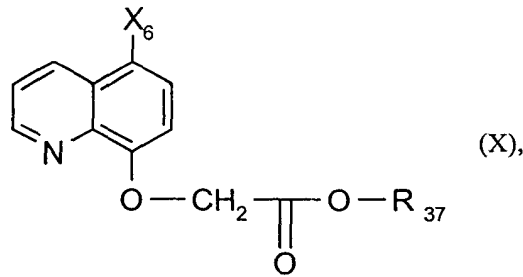
因此, 本发明提供了选择性的除草组合物其除了常规的惰性剂型助剂如载体、溶剂和湿润剂之外, 作为活性成分, 含有下述(a)和(b)的混合物:

a) 除草有效量的式 I 化合物:



(I),

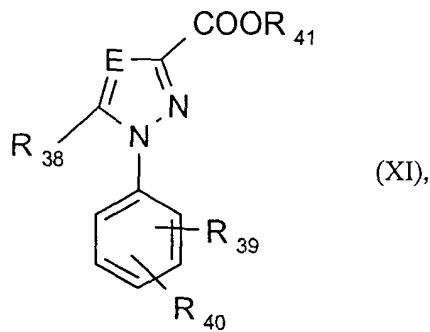
其中 R_1 , R_3 和 Q 如上文定义, 条件是 Q 不能是 Q_1 ; 和
b) 除草拮抗有效量的下式X化合物:



其中

R_{37} 是氢, C_1 - C_8 烷基, 或 C_1 - C_6 烷氧基或 C_3 - C_6 链烯氧基取代的 C_1 - C_8 烷基; 和 X_7 是氢或氯;

或下式XI化合物:



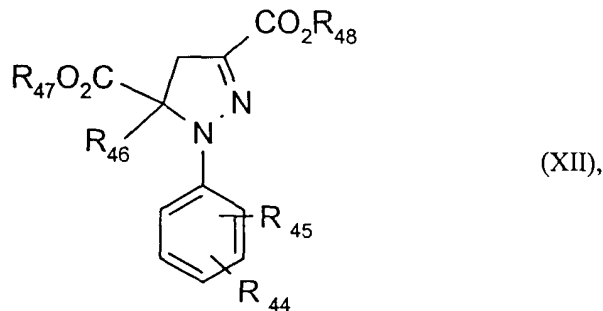
其中E 是氢或次甲基;

R_{38} 是 $-CCl_3$, 苯基或卤素取代的苯基;

R_{39} 和 R_{40} 各自相互独立地是氢或卤素; 和

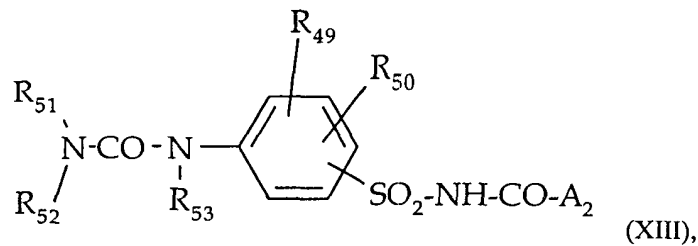
R_{41} 是 C_1 - C_4 烷基;

或下式XII化合物:

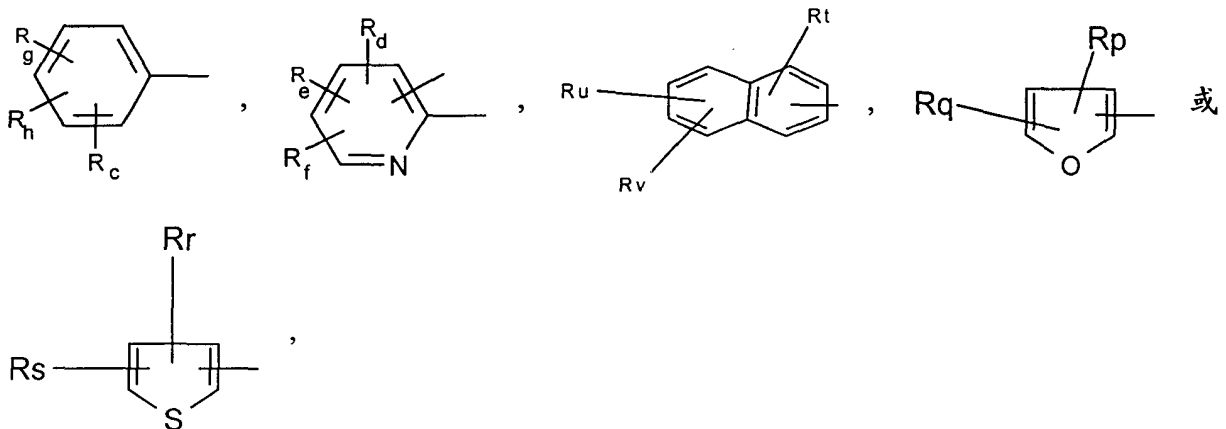


其中 R_{44} 和 R_{45} 各自相互独立地是氢或卤素, R_{46} , R_{47} 和 R_{48} 各自相互

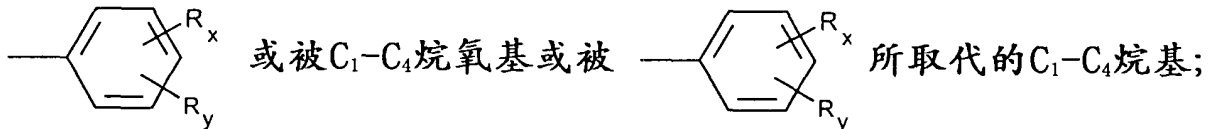
独立地是C₁-C₄烷基；
或下式化合物XIII：



其中A₂是下述基团：



R₅₁和R₅₂各自相互独立地是氢、C₁-C₈烷基、C₃-C₈环烷基、C₃-C₆链烯基、C₃-C₆链炔基，



或R₅₁和R₅₂一起形成C₄-C₆亚烷基桥，该桥可被氧、硫、SO、SO₂、NH或-N(C₁-C₄烷基)-所间断；

R₅₃是氢或C₁-C₄烷基；

R₄₉是氢，卤素，氰基，三氟甲基，硝基，C₁-C₄烷基，C₁-C₄烷氧基，C₁-C₄烷硫基，C₁-C₄烷基亚磺酰基，C₁-C₄烷基磺酰基，-COOR_j，-CONR_kR_m，-COR_n，-SO₂NR_kR_m或-OSO₂-C₁-C₄烷基；

R_g是氢，卤素，氰基，硝基，C₁-C₄烷基，C₁-C₄卤代烷基，C₁-C₄烷硫基，C₁-C₄烷基亚磺酰基，C₁-C₄烷基磺酰基，-COOR_j，-CONR_kR_m，-COR_n，-SO₂NR_kR_m或-OSO₂-C₁-C₄烷基，C₁-C₆烷氧基，或被C₁-C₄烷氧基或卤素取代的C₁-C₆烷氧基，C₃-C₆链烯氧基，或被卤素取代的C₃-C₆链烯氧基，或

C₃-C₆链炔氧基, 或R₄₉和R₅₀一起形成可被C₁-C₄烷基或卤素取代的C₃-C₄亚烷基桥, 或一起形成可被C₁-C₄烷基或卤素取代的C₃-C₄亚链烯基桥, 或一起形成可被C₁-C₄烷基或卤素取代的C₄亚二烯基桥;

R₅₀和R_n各自相互独立地是氢, 卤素, C₁-C₄烷基, 三氟甲基, C₁-C₆烷氧基, C₁-C₆烷硫基或-COOR_j;

R_c是氢, 卤素, 硝基, C₁-C₄烷基或甲氧基; R_d是氢, 卤素, 硝基, C₁-C₄烷基, C₁-C₄烷氧基, C₁-C₄烷硫基, C₁-C₄烷基亚磺酰基, C₁-C₄烷基磺酰基, -COOR_j, 或-CONR_kR_m;

R_e是氢, 卤素, C₁-C₄烷基, -COOR_j, 三氟甲基或甲氧基, 或R_d和R_e一起形成C₃-C₄亚烷基桥;

R_p是氢, 卤素, C₁-C₄烷基, -COOR_j, 三氟甲基或甲氧基; R_q是氢, 卤素, 硝基, C₁-C₄烷基, C₁-C₄烷氧基, C₁-C₄烷硫基, C₁-C₄烷基亚磺酰基, C₁-C₄烷基磺酰基, -COOR_j, 或-CONR_kR_m; 或R_p和R_q一起形成C₃-C₄亚烷基桥;

R_r是氢, 卤素, C₁-C₄烷基, -COOR_j, 三氟甲基或甲氧基; R_s是氢, 卤素, 硝基, C₁-C₄烷基, C₁-C₄烷氧基, C₁-C₄烷硫基, C₁-C₄烷基亚磺酰基, C₁-C₄烷基磺酰基, -COOR_j, 或-CONR_kR_m; 或R_r和R_s一起形成C₃-C₄亚烷基桥;

R_t是氢, 卤素, C₁-C₄烷基, -COOR_j, 三氟甲基或甲氧基; R_u是氢, 卤素, 硝基, C₁-C₄烷基, C₁-C₄烷氧基, C₁-C₄烷硫基, C₁-C₄烷基亚磺酰基, C₁-C₄烷基磺酰基, -COOR_j, 或-CONR_kR_m; 或R_t和R_u一起形成C₃-C₄亚烷基桥;

R_f和 R_v 是氢, 卤素或C₁-C₄烷基;

R_x和R_y各自相互独立地是氢, 卤素, C₁-C₄烷基, C₁-C₄烷氧基, C₁-C₄烷硫基, -COOR₅₄, 三氟甲基, 硝基或氰基;

R_j、R_k 和 R_m各自相互独立地是氢或C₁-C₄烷基; 或

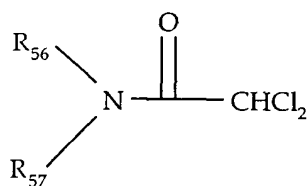
R_k和R_m一起形成C₄-C₆亚烷基桥, 该桥可被氧、NH或-N(C₁-C₄烷基)-间断;

R_n是C₁-C₄烷基, 苯基, 或被卤素、C₁-C₄烷基、甲氧基、硝基或三

氟甲基取代的苯基;

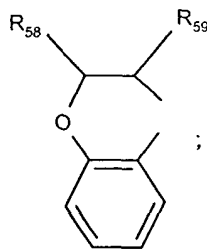
R_{54} 是氢, C_1-C_{10} 烷基, C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_4 烷基, C_1-C_4 烷硫基- C_1-C_4 烷基, 二- C_1-C_4 -烷基氨基- C_1-C_4 烷基, 卤代- C_1-C_8 烷基, C_2-C_8 链烯基, 卤代- C_2-C_8 链烯基, C_3-C_8 链炔基, C_3-C_7 环烷基, 卤代- C_3-C_7 环烷基, C_1-C_8 烷基羰基, 烯丙基羰基, C_3-C_7 环烷基羰基, 苯甲酰基, 所述的苯甲酰基是未取代的或是在其苯环上被相同或不同的至多三个选自卤素、 C_1-C_4 烷基、卤代- C_1-C_4 烷基、卤代- C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 烷氧基的取代基所取代; 或吡喃甲酰基, 噻吩基; 或被苯基, 卤代苯基, C_1-C_4 烷基-苯基, C_1-C_4 烷氧基苯基, 卤代- C_1-C_4 烷基苯基, 卤代- C_1-C_4 烷氧基苯基, C_1-C_6 烷氧基-羰基, C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_8 烷氧羰基, C_3-C_8 链烯氧基羰基, C_3-C_8 链炔氧基-羰基, C_1-C_8 烷硫基羰基, C_3-C_8 链烯硫基羰基, C_3-C_8 链炔硫基羰基, 氨基甲酰基, 一- C_1-C_4 烷基氨基羰基, 二- C_1-C_4 烷基氨基羰基取代的 C_1-C_4 烷基; 或苯基氨基-羰基, 该基团是未取代的或是在其苯环上被相同或不同的至多三个选自卤素、 C_1-C_4 烷基、卤代- C_1-C_4 烷基、卤代- C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 烷氧基的取代基所取代, 或被氰基或硝基取代一次; 或二氧戊环-2-基, 该基团是未取代的或是被 C_1-C_4 烷基取代一或二次, 或二氧六环-2-基, 该基团是未取代的或是被 C_1-C_4 烷基取代一或二次, 或被氰基、硝基、羧基或 C_1-C_8 烷硫基- C_1-C_8 烷氧基-羰基取代的 C_1-C_4 烷基;

或下式XIV化合物:



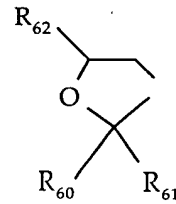
(XIV), 其中 R_{56} 和 R_{57} 各自相互独立地是 C_1-C_6 烷

基或 C_2-C_6 链烯基; 或 R_{56} 和 R_{57} 一起是



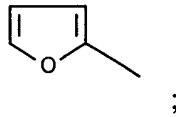
; R_{58} 和 R_{59} 各自相互

独立地是氢或 C_1-C_6 烷基；或 R_{56} 和 R_{57} 一起是

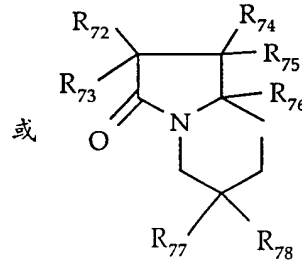
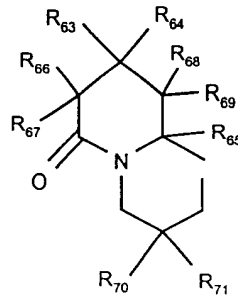


R_{60} 和 R_{61} 各自相互独立地是 C_1-C_4 烷基，或 R_{60} 和 R_{61} 一起是 $-(CH_2)_5-$ ；

R_{62} 是氢， C_1-C_4 烷基或

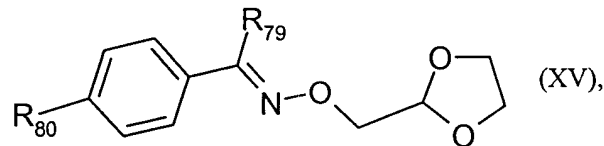


或 R_{56} 和 R_{57} 一起是：



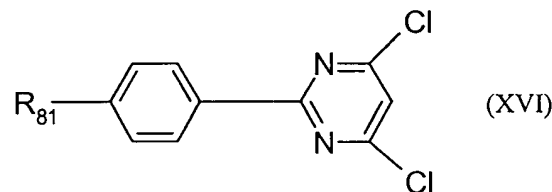
R_{63} , R_{64} , R_{65} , R_{66} , R_{67} , R_{68} , R_{69} , R_{70} , R_{71} , R_{72} , R_{73} , R_{74} , R_{75} , R_{76} , R_{77} 和 R_{78} 各自相互独立地是氢或 C_1-C_4 烷基；

或下式 XV 化合物：



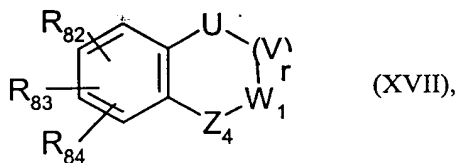
其中 R_{80} 是氢或氯，和 R_{79} 是氰基或三氟甲基；

或下式 XVI 化合物：



其中 R_{81} 是氢或甲基；

或下式 XVII 化合物：



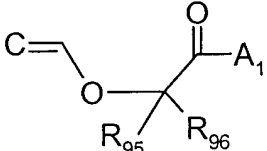
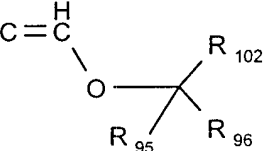
其中

R_{82} 是氢, C_1-C_4 烷基, 或被 C_1-C_4 烷基- X_2 -或 C_1-C_4 卤代烷基- X_2 -取代的 C_1-C_4 烷基, 或是 C_1-C_4 卤代烷基, 硝基, 氰基, $-COOR_{85}$, $-NR_{86}R_{87}$, $-SO_2NR_{88}R_{89}$ 或 $-CONR_{90}R_{91}$;

R_{83} 是氢, 卤素, C_1-C_4 烷基, 三氟甲基, C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 卤代烷氧基;

R_{84} 是氢, 卤素或 C_1-C_4 烷基;

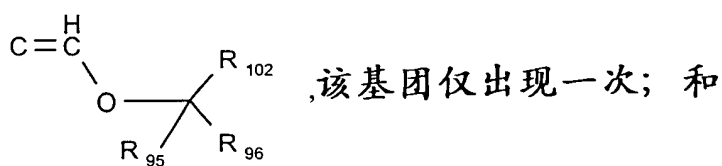
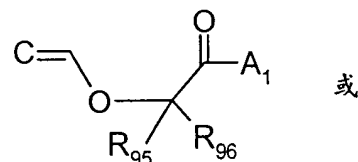
U、V、 W_1 和 Z_4 各自相互独立地是氧, 硫, $C(R_{92})R_{93}$, 羰基, NR_{94} , 或下

式基团:  或  , 其中 R_{102} 是 C_2-C_4 链烯

基或 C_2-C_4 链炔基; 条件是:

a) 环成员 U、V、 W_1 或 Z_4 中至少有一个是羰基, 并且与该环成员或这些

环成员相邻的环成员是下述基团:



b) 两个相邻的环成员 U 和 V、V 和 W_1 以及 W_1 和 Z_4 不能同时是氧;

R_{95} 和 R_{96} 各自相互独立地是氢或 C_1-C_8 烷基; 或

R_{95} 和 R_{96} 一起形成 C_2-C_6 亚烷基基团;

A_1 是 $R_{99}-Y_1$ -或 $-NR_{97}R_{98}$;

X_2 是氧或 $-S(O)_s$;

Y_1 是氧或硫;

R_{99} 是氢, C_1-C_8 烷基, C_1-C_8 卤代烷基, C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_8 烷基, C_3-C_6 链烯氧基- C_1-C_8 烷基, 或其中的苯环可被卤素、 C_1-C_4 -烷基、三氟甲基, 甲氧基或甲基-S(O)_s-取代的苯基- C_1-C_8 烷基, 或是 C_3-C_6 链烯基, C_3-C_6 卤代链烯基, 苯基- C_3-C_6 链烯基, C_3-C_6 链炔基, 苯基- C_3-C_6 链炔基, 氧杂环丁烷基, 咪喃基或四氢咪喃基;

R_{85} 是氢或 C_1-C_4 烷基;

R_{86} 是氢, C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 烷基羰基;

R_{87} 是氢或 C_1-C_4 烷基; 或

R_{86} 和 R_{87} 一起形成 C_4 -或 C_5 -亚烷基基团;

R_{88} 、 R_{89} 、 R_{90} 和 R_{91} 各自相互独立地是氢或 C_1-C_4 烷基; 或 R_{88} 与 R_{89} 一起, 或 R_{90} 与 R_{91} 一起各自相互独立地是 C_4 -或 C_5 -亚烷基, 其中的一个碳原子可被氧或硫代替, 或者一个或二个碳原子可被-NR₁₀₀-代替;

R_{92} 、 R_{100} 和 R_{93} 各自相互独立地是氢或 C_1-C_8 烷基; 或

R_{92} 和 R_{93} 一起是 C_2-C_6 亚烷基;

R_{94} 是氢或 C_1-C_8 烷基;

R_{97} 是氢, C_1-C_8 烷基, 苯基或苯基- C_1-C_8 烷基, 其中的苯环可被氟、氯、溴、硝基、氰基、-OCH₃、 C_1-C_4 烷基或CH₃SO₂-所取代, 或是 C_1-C_4 烷氧基- C_1-C_8 烷基, C_3-C_8 链烯基或 C_3-C_6 链炔基;

R_{98} 是氢, C_1-C_8 烷基, C_3-C_6 链烯基或 C_3-C_8 链炔基; 或

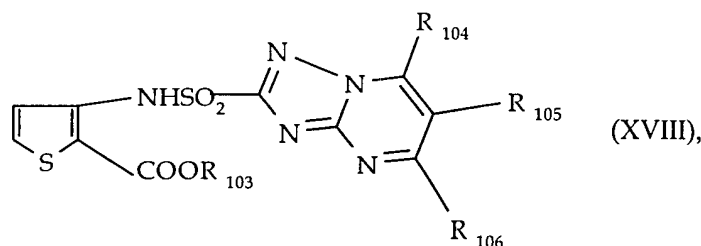
R_{97} 和 R_{98} 一起是 C_4 -或 C_5 -亚烷基, 其中一个碳原子可被氧或硫代替, 或者一个或二个碳原子可被-NR₁₀₁-代替;

R_{101} 是氢或 C_1-C_4 烷基;

r 是0或1; 和

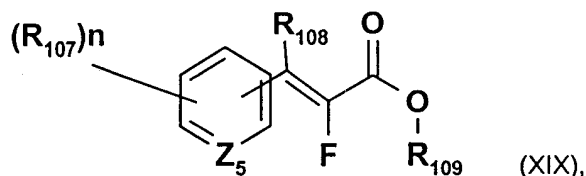
s 是0、1或2,

或下式化合物XVIII:



其中 R_{103} 是氢, C_1-C_6 烷基, C_3-C_6 环烷基, C_3-C_6 链烯基或 C_3-C_6 链炔基;
以及 R_{104} 、 R_{105} 和 R_{106} 各自相互独立地是氢, C_1-C_6 烷基, C_3-C_8 环烷基或 C_1-C_6
烷氧基, 条件是取代基 R_{104} 、 R_{105} 和 R_{106} 之一不是氢;

或下式化合物XIX:

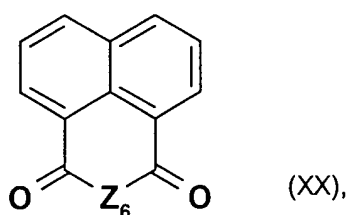


其中 Z_5 是N或CH, 当 Z_5 是N时, n 是0, 1, 2或3, 当 Z_5 是CH时, n 是0, 1, 2, 3
或4,

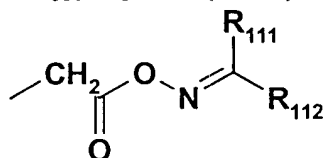
R_{107} 是卤素, C_1-C_4 烷基, C_1-C_4 卤代烷基, C_1-C_4 烷氧基, C_1-C_4 卤代烷
氧基, 硝基, C_1-C_4 烷硫基, C_1-C_4 烷基磺酰基, C_1-C_4 烷氧羰基, 苯基或
苯氧基, 或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧
基、卤素、氰基或硝基取代的苯基或苯氧基;

R_{108} 是氢或 C_1-C_4 烷基, R_{109} 是氢, C_1-C_4 烷基, C_3-C_6 环烷基, C_2-C_6 链
烯基, C_2-C_6 链炔基, C_1-C_4 卤代烷基, C_2-C_6 卤代链烯基, C_2-C_6 卤代链炔
基, C_1-C_4 烷硫基- C_1-C_4 烷基, C_1-C_4 烷基磺酰基- C_1-C_4 烷基, C_1-C_4 烷氧基
- C_1-C_4 烷基, C_1-C_4 链烯氧基- C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 -链炔氧基- C_1-C_4 烷基;

或下式XX化合物:

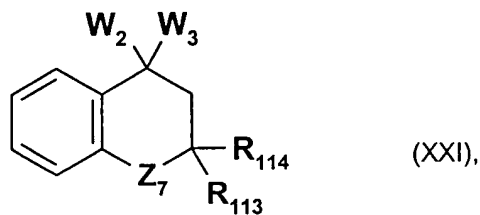


其中 Z_6 是氧或N- R_{110} , 和 R_{110} 是下式基团:



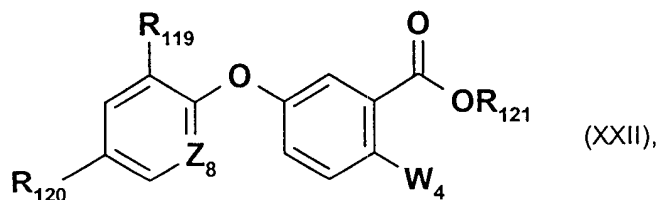
其中 R_{111} 和 R_{112} 各自相互独立地是氰基, 氢, C_1-C_4 烷基, C_3-C_6 环烷基,
 C_2-C_6 链烯基, 芳基, 苯基或杂芳基, 或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 卤代烷基、
 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的苯基、芳基
或杂芳基,

或下式 XXI 化合物:

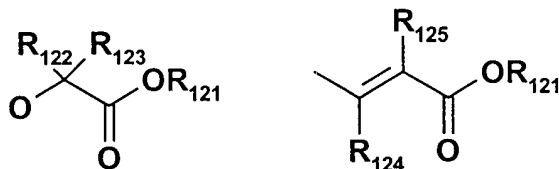


其中 Z_7 是氧, 硫, $S=O$, SO_2 或 CH_2 , R_{113} 和 R_{114} 各自相互独立地是氢, 卤素或 C_1 - C_4 烷基, W_2 和 W_3 各自相互独立地是 CH_2COOR_{115} 或 $COOR_{0115}$ 或一起是基团 $-(CH_2)C(O)-O-C(O)-(CH_2)-$, 和

R_{115} 与 R_{0115} 各自相互独立地是氢, C_1 - C_4 烷基, C_2 - C_4 链烯基, C_2 - C_6 -链炔基, C_3 - C_6 环烷基, C_1 - C_4 卤代烷基, 或金属阳离子或铵阳离子;
或下式 XXII 化合物:

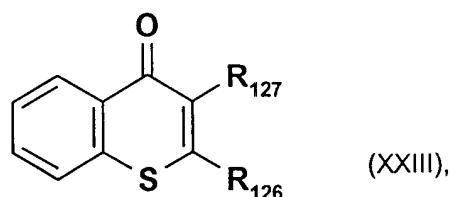


其中 R_{119} 和 R_{120} 各自相互独立地是氢, 卤素或 C_1 - C_4 卤代烷基, R_{121} 是氢, C_1 - C_4 烷基, C_3 - C_4 链烯基, C_3 - C_4 链炔基, C_1 - C_4 卤代烷基, C_3 - C_6 环烷基, 金属阳离子或铵阳离子, Z_8 是N, CH, C-F 或C-Cl 以及 W_4 是下式基团:



其中 R_{122} 和 R_{123} 各自相互独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基, 和 R_{124} 与 R_{125} 各自相互独立地是氢或 C_1 - C_4 烷基;

或下式 XXIII 化合物:

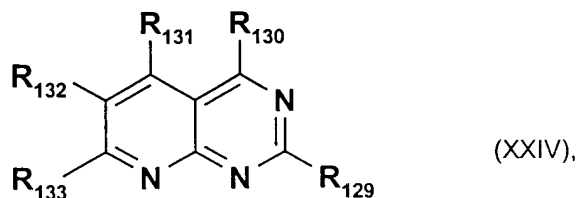


其中 R_{126} 是氢, 氨基, 卤素, C_1 - C_4 烷基, C_3 - C_6 环烷基, C_1 - C_4 烷氧基, C_1 - C_4 -

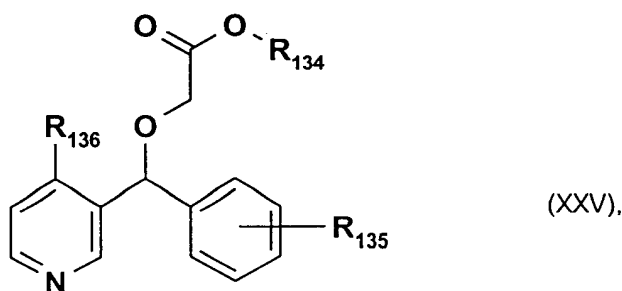
烷氧羰基, C_1 - C_4 烷硫基羰基, $-NH-R_{128}$, $-C(O)NH-R_{0128}$, 芳基或杂芳基, 或被 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 卤代烷基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的芳基或杂芳基;

R_{127} 是氢, 氰基, 硝基, 卤素, C_1 - C_4 烷基, C_1 - C_4 卤代烷基, C_1 - C_4 烷氧基或 C_1 - C_4 硫烷基; 和

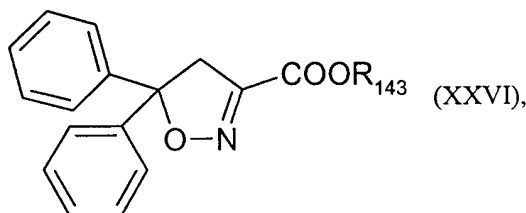
R_{128} 和 R_{0128} 各自相互独立地是 C_1 - C_4 烷基, C_1 - C_4 卤代烷基, C_3 - C_4 链烯基, C_3 - C_4 链炔基, C_3 - C_4 环烷基, 芳基或杂芳基, 或被 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 卤代烷基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 卤代烷氧基、卤素、氰基或硝基取代的芳基或杂芳基, 甲酰基, C_1 - C_4 烷基羰基或 C_1 - C_4 烷基磺酰基; 或下式XXIV化合物:



其中 R_{129} 和 R_{130} 各自相互独立地是氢, C_1 - C_4 烷基, C_1 - C_4 卤代烷基, C_1 - C_4 烷氧基, $-C_1$ - C_8 -或二- C_1 - C_8 -烷基氨基, C_3 - C_6 环烷基, C_1 - C_4 硫烷基, 苯基或杂芳基, R_{131} 具有 R_{129} 的定义, 并且另外还可以是OH, NH_2 , 卤素, 二- C_1 - C_4 氨基烷基, C_1 - C_4 烷硫基, C_1 - C_4 烷基磺酰基或 C_1 - C_4 烷氧羰基, R_{132} 具有 R_{129} 的定义, 并且另外还可以是氰基, 硝基, 羧基, C_1 - C_4 烷氧羰基, 二- C_1 - C_4 -氨基烷基, C_1 - C_4 烷硫基, C_1 - C_4 烷基磺酰基, SO_2-OH , *i*- C_1 - C_4 氨基烷基磺酰基或 C_1 - C_4 -烷氧基磺酰基, R_{133} 具有 R_{129} 的定义, 并且另外还可以是OH, NH_2 , 卤素, 二- C_1 - C_4 -氨基烷基, 吡咯烷-1-基, 哌啶-1-基, 吗啉-1-基, C_1 - C_4 烷硫基, C_1 - C_4 烷基磺酰基, C_1 - C_4 烷氧羰基, 苯氧基, 萘氧基, 苯基氨基, 苯甲酰氧基或苯基磺酰氧基; 或下式XXV化合物:



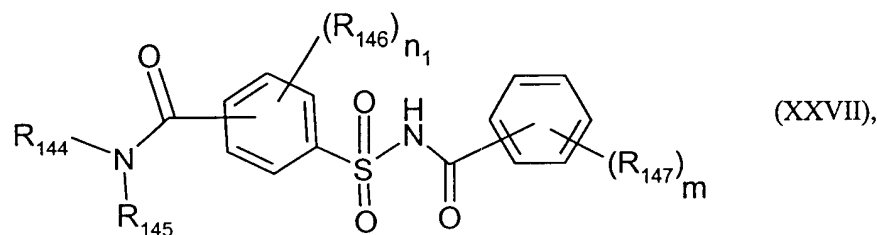
其中 R_{134} 是氢, C_4 烷基, C_1 - C_4 卤代烷基, C_2 - C_4 链烯基, C_2 - C_4 链炔基或 C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基, R_{135} 是氢, 卤素, C_1 - C_4 烷基, C_1 - C_4 卤代烷基或 C_1 - C_4 烷氧基, 和 R_{136} 是氢, 卤素, C_1 - C_4 烷基, C_1 - C_4 卤代烷基或 C_1 - C_4 烷氧基, 条件是 R_{135} 和 R_{136} 不能同时为氢, 或下式XXVI化合物:



其中

R_{143} 是氢, 碱金属阳离子, 碱土金属阳离子, 铕阳离子或铵阳离子或乙基;

或下式XXVII化合物:



其中 R_{144} 和 R_{145} 各自相互独立地是氢, C_1 - C_6 烷基, C_2 - C_6 -链烯基, C_2 - C_6 链炔基或 C_3 - C_6 环烷基;

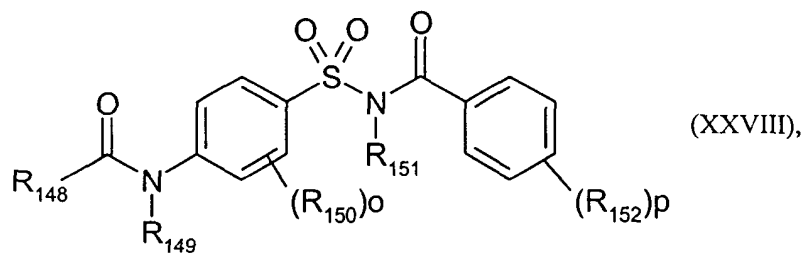
R_{146} 是氢, 卤素, C_1 - C_4 烷基, C_1 - C_6 卤代烷基或 C_1 - C_6 卤代烷氧基;

R_{147} 是氢, 卤素, C_1 - C_4 烷基, C_1 - C_4 卤代烷基, C_1 - C_4 烷氧基, C_1 - C_4 卤代烷氧基, C_1 - C_4 -烷硫基, C_1 - C_4 烷氧羰基或硝基;

n_1 是0, 1, 2或3; 和

m 是1 或2;

或下式 XXVIII化合物:



其中

R_{148} 是氢, C_1-C_6 烷基, C_1-C_6 烷氧基, C_1-C_6 烷硫基, C_3-C_8 环烷基, 苯基, 苯基 C_1-C_6 烷基或杂芳基; 其中所述的基团可被卤素, 氰基, 硝基, 氨基, 羟基, 羰基, 羧基, 甲酰基, 甲酰胺或磺酰胺取代;

R_{149} 是氢, C_1-C_6 烷基或 C_1-C_4 卤代烷基;

每个 R_{150} 各自相互独立地是氢, 卤素, C_1-C_4 烷基, C_1-C_4 卤代烷基, C_1-C_4 烷氧基, C_1-C_4 烷硫基, C_1-C_4 烷基磺酰基, 氰基, 硝基, 甲酰基或羧基;

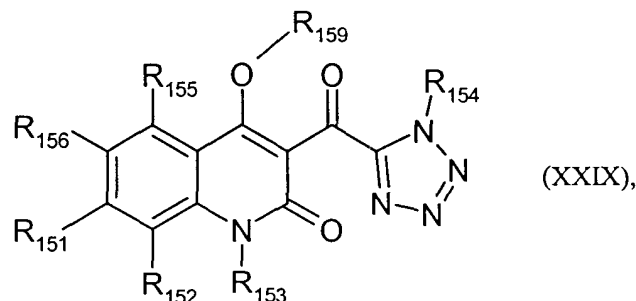
R_{151} 是氢, C_1-C_6 烷基或 C_1-C_4 卤代烷基;

每个 R_{152} 各自相互独立地是氢, 卤素, C_1-C_4 烷基, C_1-C_4 卤代烷基, C_1-C_4 烷氧基, C_1-C_4 烷硫基, C_1-C_4 烷基磺酰基, 氰基, 硝基, 甲酰基或羧基;

o是0, 1, 或2, 和

p 是0, 1或2;

或下式XXIX化合物:



其中

R_{159} 是氢, 甲酰基, C_1-6 烷基羰基, C_1-6 链烯基羰基, C_1-6 链炔基羰基, C_1-6 烷氧基羰基, C_1-6 烷硫基羰基, C_3-8 环烷基羰基, 苯基- C_1-6 烷基羰基,

苯基羰基, C_{1-6} 烷基磺酰基, C_{1-6} 链烯基磺酰基或苯基磺酰基, 其中前述的烃基基团可被一个或多个卤素原子、氰基、硝基、氨基、甲氧基、乙氧基或苯基取代;

R_{153} 是氢, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 链烯基, C_{1-6} 链炔基, C_{3-8} 环烷基, 甲酰基, C_{1-6} 烷基羰基, C_{1-6} 链烯基羰基, C_{1-6} 链炔基羰基, C_{1-6} 烷氧羰基, C_{1-6} 烷硫基羰基, C_{3-8} 环烷基羰基, C_{1-6} 烷基磺酰基, C_{1-6} 链烯基磺酰基或苯基磺酰基, 其中前述的烃基基团可被一个或多个卤素原子、氰基、硝基、氨基、甲氧基、乙氧基或苯基取代;

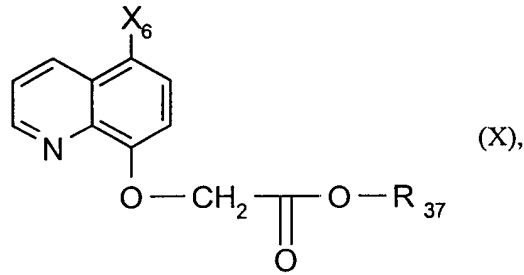
R_{154} 是氢, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 链烯基, C_{1-6} 链炔基, C_{3-8} 环烷基, 甲酰基, C_{1-6} 烷基羰基, C_{1-6} 链烯基羰基, C_{1-6} 链炔基羰基, C_{1-6} 烷氧基羰基, C_{1-6} 烷硫基羰基, C_{3-8} 环烷基羰基, C_{1-6} 烷基磺酰基, C_{1-6} 链烯基磺酰基或苯基磺酰基, 其中前述的烃基基团可被一个或多个卤素原子、氰基、硝基、氨基、甲氧基、乙氧基或苯基取代;

R_{155} 、 R_{156} 、 R_{157} 和 R_{158} 各自相互独立地是氢, 卤素, 氨基, C_{1-3} 烷基氨基, C_{1-6} 二烷基氨基, 羟基, 氰基, 硝基, 甲酰基, 羧基, C_{1-6} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷氧基, C_{1-6} 烷基羰基, C_{1-6} 烷氧基羰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 链烯基或 C_{1-6} 链炔基;

或 R_{153} 和 R_{158} 一起与它们所键连的环原子一起形成5-或6-元的部分饱和或不饱和的环, 该环最多可含有两个相同或不同的选自氧、硫和氮的杂原子, 该环可被氧代基团取代。

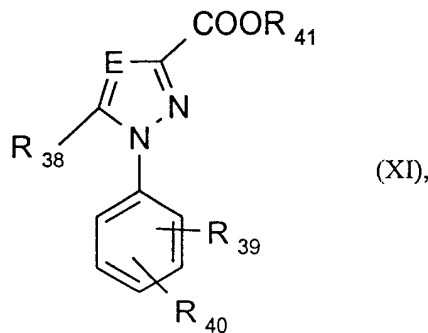
优选本发明的组合物含有拮抗除草剂有效量的式 X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV 或 XXV 的安全剂。

优选的, 按照本发明的选择性除草组合物含有拮抗除草剂有效量的式X化合物:



其中R₃₇是氢, C₁-C₈烷基, 或被C₁-C₆烷氧基或C₃-C₆-链烯氧基取代的C₁-C₈烷基; 和X₆是氢或氯;

或下式XI化合物:



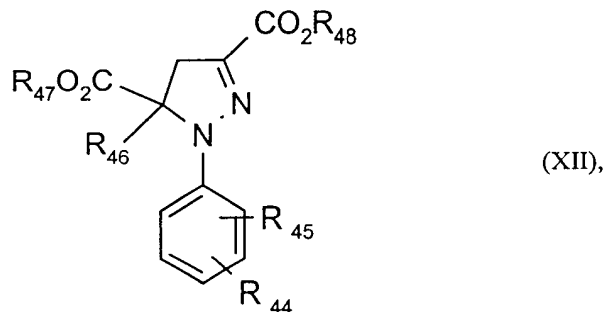
其中

E是氮或次甲基; R₃₈是-CCl₃、苯基或卤素取代的苯基;

R₃₉和R₄₀各自相互独立地是氢或卤素; 和

R₄₁是C₁-C₄烷基;

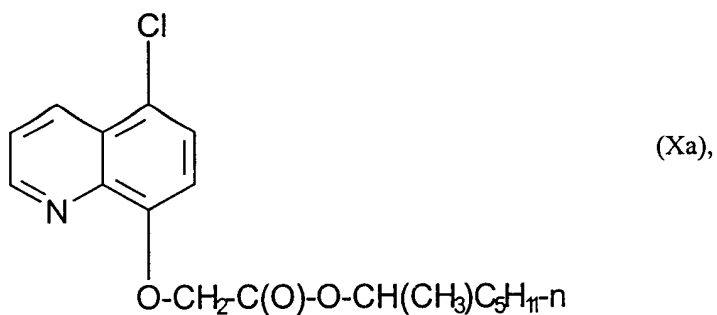
或下式XII化合物:



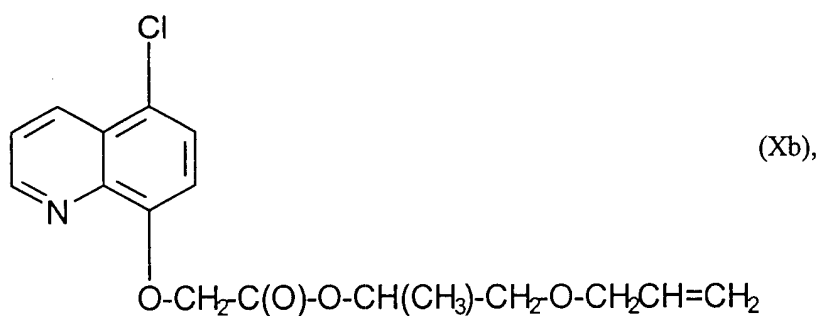
其中R₄₄和R₄₅各自相互独立地是氢或卤素, 以及R₄₆、R₄₇和R₄₈各自相互独立地是C₁-C₄烷基。

上述优选的式I化合物也适用于式I化合物与式X-XVIII的安全剂的混合物。本发明优选的组合物含有选自下述各式的安全剂:

式Xa:



式Xb:



和式XIa:

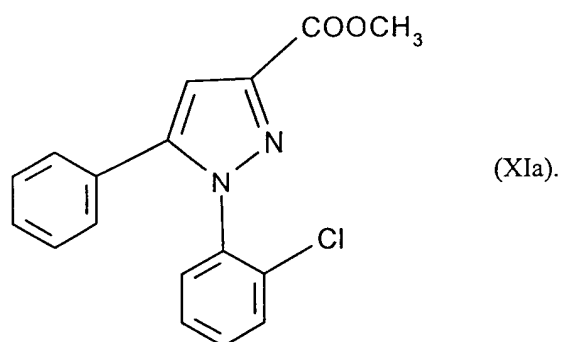
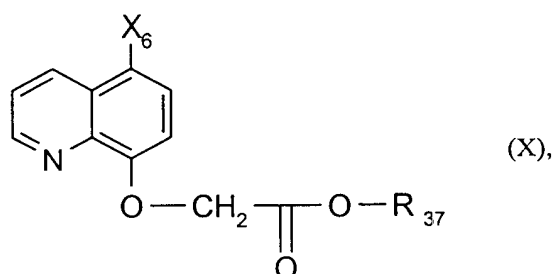


表9、10和11中还列出了其它优选的式X、XI和XII化合物。

表9: 式X化合物



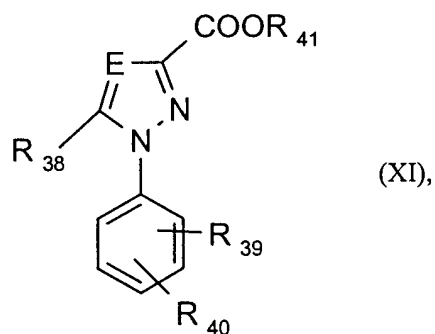
化合物编号 X₆ R₃₇

9.01	Cl	-CH(CH ₃)-C ₅ H _{11-n}
9.02	Cl	-CH(CH ₃)-CH ₂ OCH ₂ CH=CH ₂

- 9.03 Cl H
9.04 Cl C₄H_{9-n}

优选的式XI化合物列于下表10.

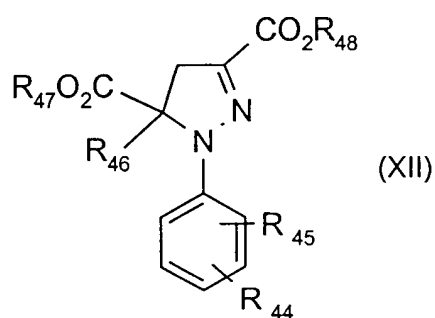
表 10: 式XI化合物:



化合物编号	R ₄₁	R ₃₈	R ₃₉	R ₄₀	E
10.01	CH ₃	苯基	2-Cl	H	CH
10.02	CH ₃	苯基	2-Cl	4-Cl	CH
10.03	CH ₃	苯基	2-F	H	CH
10.04	CH ₃	2-氯苯基	2-F	H	CH
10.05	C ₂ H ₅	CCl ₃	2-Cl	4-Cl	N
10.06	CH ₃	苯基	2-Cl	4-CF ₃	N
10.07	CH ₃	苯基	2-Cl	4-CF ₃	N

优选的式XII化合物列于下表11.

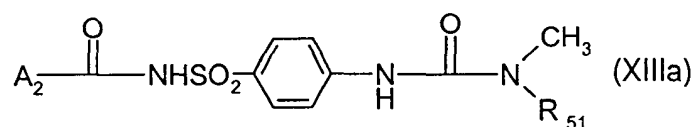
表 11: 式XII化合物:



化合物编号	R ₄₆	R ₄₇	R ₄₈	R ₄₄	R ₄₅
11.01	CH ₃	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl
11.02	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	2-Cl	4-Cl
11.03	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	2-Cl	4-Cl

优选的式XIII化合物列于下表12, 作为式XIIIa化合物。

表 12: 式XIIIa化合物:

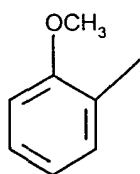


化合物编号

A₂

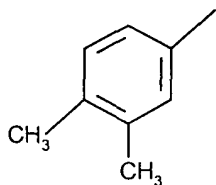
R₅₁

12.001



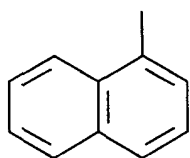
H

12.002



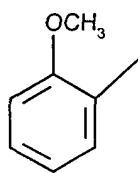
H

12.003



CH₃

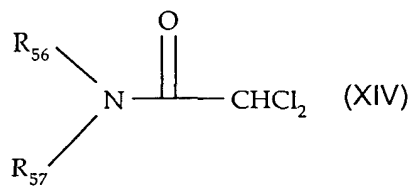
12.004



CH₃

优选的式XIV化合物列于下表13。

表 13: 式XIV化合物:

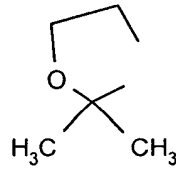
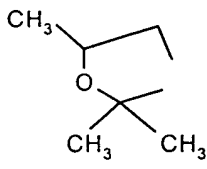
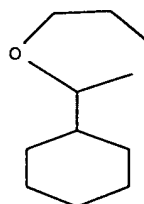
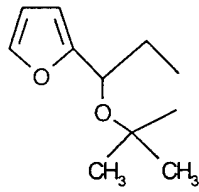
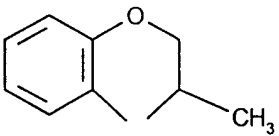
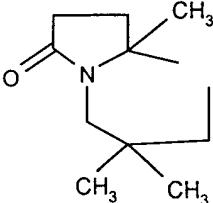
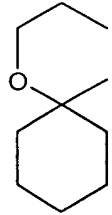


化合物编号

R₅₆

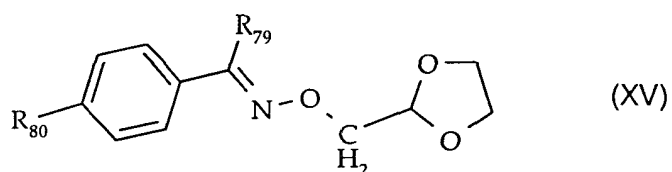
R₅₇

R₅₆+R₅₇

13.001	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2$	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2$	-
13.002	--	--	
13.003	--	--	
13.004	-	-	
13.005	--	--	
13.006	--	--	
13.007	--	--	
13.008	--	--	

优选的式XV化合物列于下表14。

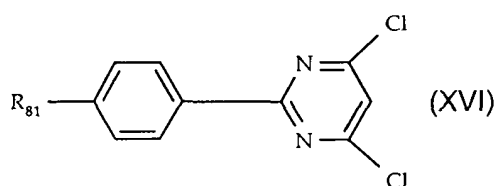
表 14: 式XV化合物:



化合物编号	R ₈₀	R ₇₉
14.01	H	CN
14.02	Cl	CF ₃

优选的式XVI化合物列于下表15。

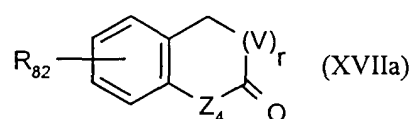
表 15: 式XVI化合物:

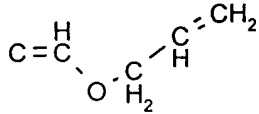
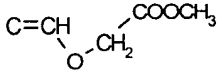
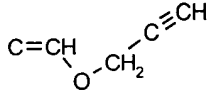
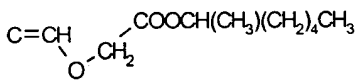
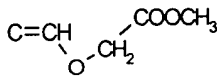
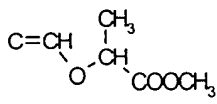
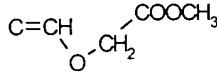
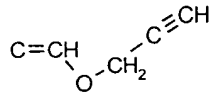
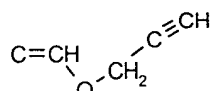
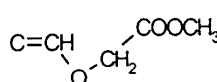
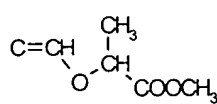
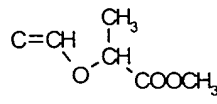
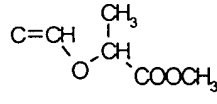


化合物编号	R ₈₁
15.01	H
15.02	CH ₃

优选的式XVII化合物列于下表16, 作为式XVIIa化合物。

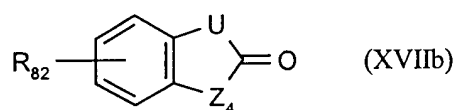
表 16: 式XVIIa化合物:



化合物编号	R ₈₂	Z ₄	V	r
16.001	H		O	1
16.002	H		O	1
16.003	H		O	1
16.004	H		O	1
16.005	H		CH ₂	1
16.006	H		CH ₂	1
16.007	H		S	1
16.008	H		S	1
16.009	H		NCH ₃	1
16.010	H		NCH ₃	1
16.011	H		NCH ₃	1
16.012	H		O	1
16.013	H		S	1

优选的式XVII化合物列于下表17，作为式XVIIb化合物。

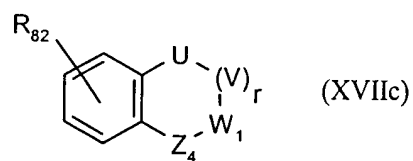
表 17: 式XVIIb化合物:

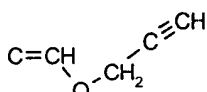
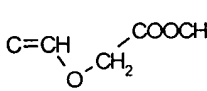
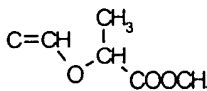
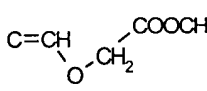
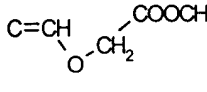
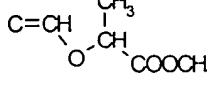
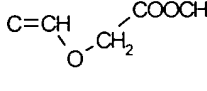


化合物编号	U	R ₈₂	Z ₄
17.001	O	H	
17.002	O	H	
17.003	O	5-Cl	
17.004	CH ₂	H	
17.005	CH ₂	H	
17.006	CH ₂	H	
17.007	NH	5-Cl	
17.008	NH	5-Cl	
17.009	NH	H	
17.010	NH	H	
17.011	NCH ₃	H	
17.012	NCH ₃	H	

优选的式XVII化合物列于下表18，作为式XVIIc化合物。

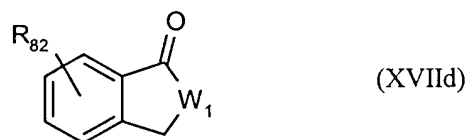
表 18: 式XVIIc化合物:

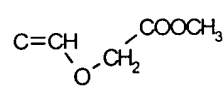
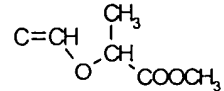
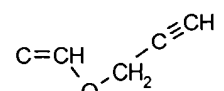
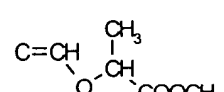
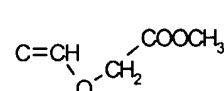


化合物编号	U	V	r	W ₁	Z ₄	R ₈₂
18.001	O	C=O	1		CH ₂	H
18.002	O	C=O	1		CH ₂	H
18.003	CH ₂	C=O	1		CH ₂	H
18.004	CH ₂	C=O	1		CH ₂	H
18.005	CH ₂	CH ₂	1		C=O	H
18.006	CH ₂	CH ₂	1		C=O	H
18.007	NCH ₃	C=O	1		CH ₂	H

优选的式XVII化合物列于下表19，作为式XVIIId化合物。

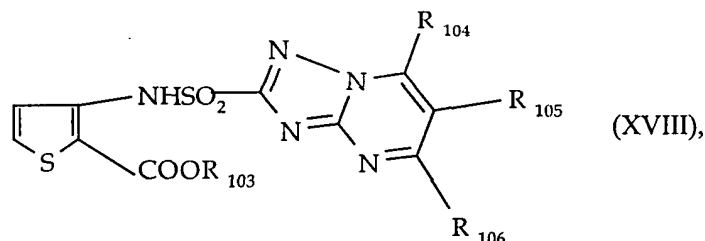
表 19: 式XVIIId化合物:



化合物编号	R ₈₂	W ₁
19.001	6-Cl	
19.002	6-Cl	
19.003	H	
19.004	H	
19.005	H	

优选的式XVIII化合物列于下表20。

表 20: 式XVIII化合物:



化合物编号	R ₁₀₃	R ₁₀₄	R ₁₀₅	R ₁₀₆
20.01	CH ₃	H	环丙基	H
20.02	CH ₃	C ₂ H ₅	环丙基	H
20.03	CH ₃	环丙基	C ₂ H ₅	H
20.04	CH ₃	CH ₃	H	H
20.05	CH ₃	CH ₃	环丙基	H
20.06	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H
20.07	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
20.08	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
20.09	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
20.10	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
20.11	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	H
20.12	H	OCH ₃	OCH ₃	H
20.13	H	CH ₃	CH ₃	H
20.14	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃
20.15	H	H	H	CH ₃
20.16	CH ₃	H	H	CH ₃
20.17	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃

在式XXVIII化合物中, 优选的是下述定义的化合物:

R₁₄₈ 是氢, C₁₋₆烷基, C₃₋₈环烷基或苯基, 其中所述基团可被卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、羧基、羧基、甲酰基、甲酰胺或磺酰胺所取代;

R₁₄₉ 是氢;

每个R₁₅₀各自相互独立地是氢, 卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄烷硫基, 氰基, 硝基或甲酰基;

R₁₅₁是氢; 和

每个R₁₅₂各自相互独立地是氢, 卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄烷硫基, 氰基, 硝基 或甲酰基。

特别优选的式XXVIII 化合物选自下述一组化合物:

2-甲氧基-N-[4-(2-甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-乙酰胺,
 N-[4-(2-甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-环丙烷甲酰胺,
 N-[4-(2-甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-环丁烷甲酰胺,
 N-[4-(2-氯苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-环丙烷甲酰胺,
 N-[4-(2-氯苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-乙酰胺,
 N-[4-(2-三氟甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-乙酰胺,
 N-[4-(2-三氟甲基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-环丙烷甲酰胺,
 N-[4-(2-三氟甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-环丙烷甲酰胺,
 N-[4-(2-三氟甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-环丁烷甲酰胺, 和
 N-[4-(2-三氟甲基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-乙酰胺。

在式XXIX化合物中, 优选的是下述定义的化合物:

R_{159} 是氢, 甲酰基, C_{1-6} 烷基羰基, C_{1-6} 链烯基羰基, C_{1-6} 链炔基羰基, C_{1-6} 烷氧基羰基, C_{1-6} 烷硫基羰基, C_{3-8} 环烷基羰基, 苯基- C_{1-6} 烷基羰基或苯基羰基, 其中上述烃基可被一或多个下述取代基取代: 卤原子、氟基、硝基、氨基、甲氧基、乙氧基或苯基;

R_{153} 是氢, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 链烯基, C_{1-6} 链炔基, 甲酰基, C_{1-6} 烷基羰基或 C_{1-6} 烷氧基羰基, 其中上述烃基可被一或多个下述取代基取代: 卤原子、氟基、硝基、氨基、甲氧基、乙氧基或苯基;

R_{154} 是氢, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 链烯基, C_{1-6} 炔基, 甲酰基, C_{1-6} 烷基羰基或 C_{1-6} 烷氧基羰基, 其中上述烃基可被一或多个下述取代基取代: 卤原子、氟基、硝基、氨基、甲氧基、乙氧基或苯基;

R_{155} 、 R_{156} 、 R_{157} 和 R_{158} 各自相互独立地是氢, 卤素, 氟基, 硝基, 甲酰基, 羧基, C_{1-6} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷氧基, C_{1-6} 烷氧基羰基, C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 卤代烷基;

或 R_{153} 和 R_{158} , 与它们所键连的环原子一起形成 5-或 6-元部分饱和或不饱和的环, 该环最多可含有 2 个相同或不同的选自氧、硫和氮的杂原子, 该环可能被氧代基团取代。

尤其优选这些式 XXIX 化合物, 其中

R_{159} 是氢、甲酰基、 C_{1-6} 烷基羰基、 C_{1-6} 链烯基羰基、链炔基羰基、 C_{1-6} 烷氧羰基、 C_{1-6} 烷硫羰基、 C_{3-8} 环烷基羰基或苯基羰基；

R_{153} 是氢、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 链烯基、 C_{1-6} 链炔基、甲酰基、 C_{1-6} 烷基羰基或 C_{1-6} 烷氧羰基；

R_{154} 是氢、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 链烯基、 C_{1-6} 链炔基、甲酰基、 C_{1-6} 烷基羰基或 C_{1-6} 烷氧羰基；

R_{155} 、 R_{156} 、 R_{157} 和 R_{158} 各自独立地是氢、卤素、氰基、硝基、甲酰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 卤代烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基；

或者 R_{153} 和 R_{158} 与它们所键连的环原子一起形成 5 或 6 元部分饱和或不饱和的环，该环可以含有至多 2 个相同或不同的选自氧、硫和氮的杂原子，该环可以被氧代基团取代。

特别优选的是选自下述一组的式 XXIX 化合物：

4-羟基-1-甲基-3-(1H-四唑-5-羰基)-1H-喹啉-2-酮，

1-乙基-4-羟基-3-(1H-四唑-5-羰基)-1H-喹啉-2-酮，

6-羟基-5-(1H-四唑-5-羰基)-1,2-二氢-吡咯并[3.2.1-ij.]喹啉-4-酮，

3-(1-乙酰基-1H-四唑-5-羰基)-4-羟基-1-甲基-1H-喹啉-2-酮，

6-氯-4-羟基-1-甲基-3-(1H-四唑-5-羰基)-1H-喹啉-2-酮，

6-氟-4-羟基-1-甲基-3-(1H-四唑-5-羰基)-1H-喹啉-2-酮，

4-羟基-1,6-二甲基-3-(1H-四唑-5-羰基)-1H-喹啉-2-酮，

4-羟基-6-甲氧基-1-甲基-3-(1H-四唑-5-羰基)-1H-喹啉-2-酮，

4-羟基-6-甲氧基-1-甲基-3-(1H-四唑-5-羰基)-1H-喹啉-2-酮，

乙酸的1-甲基-2-氧代-3-(1H-四唑-5-羰基)-1,2-二氢-喹啉-4-基酯，
和

2,2-二甲基丙酸的1-甲基-2-氧代-3-(1H-四唑-5-羰基)-1,2-二氢喹啉-4-基酯。

本发明还涉及在有用植物的作物中选择性防治杂草的方法，该方法包括用除草有效量的式 I 除草剂和拮抗除草剂有效量的式 X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、

XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIII或XXIX的安全剂或同时，或分别处理有用的植物、其种子或插条，或处理它们的种植区，优选的安全剂是式X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII或XVIII化合物。

式X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII或XVIII的安全剂可以保护其不受上述除草剂损伤的适当的种植植物尤其是禾谷类、棉花、大豆、甜菜、甘蔗、栽培作物、油菜、玉米或稻，更尤其是玉米或禾谷类。应当理解的是，作物包括用常规培育方法或遗传工程方法培育的而对除草剂或各类除草剂有耐受性的那些作物。

欲防治的杂草可以是单子叶或双子叶杂草，例如单子叶杂草燕麦属，剪股颖属，藜草属，黑麦草属，雀麦属，看麦娘属，狗尾草属，马唐属，臂形草属，稗属，黍属，石茅/高粱，筒轴茅属，莎草属，稗属，草属，雨久花属，慈菇属和繁缕属，以及双子叶杂草白芥属，藜属，猪殃殃属，堇菜属，婆婆纳属，母菊属(Matricaria)，罂粟属(Papaver)，茄属，苘麻属，黄花稔属，苍耳属，苋属，番薯属和苘蒿属。

种植区是指其上植物已经生长的区域，或其上已经种植了植物的种子的区域，以及，打算种植植物的区域。

根据目的不同，可以使用式X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIII或XXIX的安全剂对这些种植植物的种子进行预处理（对种子和插条进行拌种处理），或在种植前或后掺混入土壤中。但它们也可单独使用，或在植物发芽后与除草剂一起使用。因此，原则上讲，用安全剂处理植物或种子与除草剂的使用时间无关。对植物进行处理时，可将除草剂和安全剂同时使用（例如桶混的形式）。相对于除草剂而言，安全剂的施用量很大程度上取决于施用的方法。在田间进行处理的情况下，施用量会受到是施用安全剂和除草剂结合在一起的桶混物，还是分别使用安全剂和除草剂的影响，除草剂与安全剂的施用比例通常为100:1-1:10，优选20:1-1:1。在田间进行处理时，通常使用0.001-1.0 kg安全剂/公顷，优选0.001-0.25 kg安全剂/公顷。

除草剂的施用量通常是0.001-2kg/ha，但优选0.005-0.5 kg/ha。

本发明的组合物适合于任何农业上常用的施用方法，例如芽前施用、苗后施用和拌种。

在用于拌种的情况下，通常使用0.001-10克安全剂/千克种子，优选0.05-2克安全剂/千克种子。当在种植前不久施用液体形式的安全剂时，可使种子溶胀，所使用的安全剂溶液的活性成分浓度为1-10000 ppm，优选100-1000 ppm是有利的。

为了进行施用，式 X, XI, XII, XIII, XIV, XV, XVI, XVII, XVIII, XIX, XX, XXI, XXII, XXIII, XXIV, XXV, XXVI, XXVII, XXVIII 或 XXIX 的安全剂，或这些安全剂与式 I 除草剂的结合有利地是与剂型技术中的常规助剂一起加工制成各种剂型，例如乳油、包衣的糊剂、直接可喷雾的或可稀释的溶液剂、稀释乳液剂、可湿性粉剂、可溶性粉剂、粉剂、颗粒剂或微胶囊。

这些剂型例如在 WO 97/34485，第 9-13 页有描述。这些剂型可以常规的方式制备，例如紧密混合/研磨活性成分与液体或固体剂型助剂，如溶剂或固体载体。另外，在制备制剂时还可使用表面活性化合物（表面活性剂）。适合于上述目的的溶剂和固体载体例如在 WO 97/34485 的第 6 页有描述。

根据需要进行剂型加工的式 I 活性成分的性质，作为表面活性化合物应考虑使用具有良好乳化性能、分散和湿润性能的非离子、阳离子和/或阴离子的表面活性剂或其混合物。适用的阴离子、非离子和/或阳离子的表面活性剂的例子例如列于 WO 97/34485 的第 7 和 8 页。还有，适用于制备本发明除草剂组合物的制剂技术中常用的表面活性剂特别描述于“《Mc Cutcheon's 洗涤剂 and 乳化剂年报》Mc Cutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual”，MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey, 1981; Stache, H., “Tensid-Taschenbuch”, Carl Hanser Verlag, Munich Nienna, 1981 以及 M. 和 J. Ash, “《表面活性剂大全》Encyclopedia of Surfactants”，第 I-III 卷, Chemical Publishing Co., New York, 1980-81 之中。

除草的制剂中通常含有 0.1-99 重量%，特别是 0.1-95 重量%的活

性成分混合物，该混合物含有式I化合物和式X, XI, XII, XIII, XIV, XV, XVI, XVII, XVIII, XIX, XX, XXI, XXII, XXIII, XXIV, XXV, XXVI, XXVII, XXVIII或XXIX，该制剂中还含有1-99.9 % 重量的固体或液体的剂型助剂，和0-25 重量%，特别是0.1-25 重量%的表面活性剂。而商业性的产品通常优选是浓缩剂，终端使用者通常使用稀释的制剂。

该组合物还可含有添加剂，如稳定剂，植物油或环氧化植物油（环氧化椰子油、菜籽油或大豆油），消泡剂如硅油，防腐剂，粘度调节剂，粘合剂，增稠剂和肥料或其它活性成分。可采用多种适当的方法和技术来应用式X, XI, XII, XIII, XIV, XV, XVI, XVII, XVIII, XIX, XX, XXI, XXII, XXIII, XXIV, XXV, XXVI, XXVII, XXVIII 或 XXIX 的安全剂，或含有它们的组合物，以保护种植的植物不受式I除草剂的危害。下面是实例：

i) 拌种

a) 用下式活性成分的可湿性粉剂拌种：X, XI, XII, XIII, XIV, XV, XVI, XVII, XVIII, XIX, XX, XXI, XXII, XXIII, XXIV, XXV, XXVI, XXVII, XXVIII 或 XXIX，在容器中振动，直到制剂在种子表面均匀地分布（干拌种）。每100g种子使用大约1-500g式X, XI, XII, XIII, XIV, XV, XVI, XVII, XVIII, XIX, XX, XXI, XXII, XXIII, XXIV, XXV, XXVI, XXVII, XXVIII或XXIX的活性成分（4g-2kg的可湿性粉剂）。

b) 按照a)的方法，用下式活性成分的乳油拌种：X, XI, XII, XIII, XIV, XV, XVI, XVII, XVIII, XIX, XX, XXI, XXII, XXIII, XXIV, XXV, XXVI, XXVII, XXVIII 或 XXIX（湿拌种）。

c) 把种子浸入含有100-1000ppm下式活性成分的液体制剂进行拌种：X, XI, XII, XIII, XIV, XV, XVI, XVII, XVIII, XIX, XX, XXI, XXII, XXIII, XXIV, XXV, XXVI, XXVII, XXVIII或 XXIX，时间是1-2小时，如果需要，接着将种子干燥（浸入法拌种）。

拌种或处理发芽的幼苗显然是优选的应用方法，因为用活性成分

的处理直接作用于整个的靶标作物。虽然根据所用的方法不同安全剂的用量不同，但通常每100g种子，使用1-1000g安全剂，优选5-250g安全剂，并且还可以加入其它活性成分或微量营养物，也可以采用超过或不足以达到特定浓度限制的量（重复拌种）。

ii) 以桶混物的形式使用

使用安全剂和除草剂混合物的液体制剂（一个与另一个的比例是10:1-1:100），除草剂的施用量为每公顷0.005-5.0 kg。这种桶混物种植前或种植后使用。

iii) 播种沟施用

以乳油、可湿性粉剂或颗粒剂的形式，将式X, XI, XII, XIII, XIV, XV, XVI, XVII, XVIII, XIX, XX, XXI, XXII, XXIII, XXIV, XXV, XXVI, XXVII, XXVIII或XXIX的活性成分引入开放的，播种种子的垄沟内。播种沟覆盖后，除草剂是以常规的芽前施用的方式施用的。

iv) 活性成分的控制释放

将式X, XI, XII, XIII, XIV, XV, XVI, XVII, XVIII, XIX, XX, XXI, XXII, XXIII, XXIV, XXV, XXVI, XXVII, XXVIII或XXIX的活性成分以溶液的形式应用于无机颗粒载体或聚合的物颗粒（脲/甲醛）并干燥。适当时，也可以涂敷能使活性成分在一定的时间内定量释放的包衣剂（包衣颗粒）。

可通过加入喷雾桶混助剂，可能会提高本发明除草或抑制植物生长的组合物的活性，所述的除草或控制植物生长的组合物含有除草有效量的式I化合物和拮抗除草剂有效量的式X, XI, XII, XIII, XIV, XV, XVI, XVII, XVIII, XIX, XX, XXI, XXII, XXIII, XXIV, XXV, XXVI, XXVII, XXVIII 或 XXIX 化合物。这些助剂例如可以是非离子表面活性剂、非离子表面活性剂的混合物、阴离子表面活性剂与非离子表面活性剂的混合物、阳离子表面活性剂、有机硅表面活性剂、有或没有

表面活性剂的矿物油衍生物，有或没有加入表面活性剂的植物油衍生物，有或没有表面活性剂的植物或矿物来源的油的烷基化衍生物，有或没有表面活性剂的动物性质的鱼油或其它动物的油或其烷基化衍生物，优选含有8-28个碳原子的天然的高级脂肪酸，和其烷基酯衍生物，含有芳环系和一个或多个羧酸酯的有机酸，和其烷基衍生物，以及乙酸乙烯酯的聚合物或乙酸乙烯酯/丙烯酸酯的共聚物的悬浮液。单个助剂相互之间的混合物以及与有机溶剂结合可能会使活性进一步提高。

适当的非离子表面活性剂例如包括脂族或环脂族醇、饱和或不饱和脂肪酸和烷基酚的聚二元醇醚的衍生物，优选含有3-30个二元醇醚基团，以及脂族烃基基团中含有8-20个碳原子，烷基酚的烷基基团中具有6-18个碳原子。

其它合适的非离子表面活性剂是水溶性的聚丙二醇、亚乙基氨基聚丙二醇和在烷基链中有1-10个碳原子的烷基聚丙二醇的聚环氧乙烷的加成物，该加成物中优选含有20-250乙二醇醚基团，和10-100丙二醇醚基团。所述的化合物中每个丙二醇单元通常含有1-5个乙二醇单元。

作为非离子表面活性剂其它的实例，还可以提及的是壬基苯酚聚乙氧基乙醇、蓖麻油聚二元醇醚、聚环氧丙烷/聚环氧乙烷加成物、三丁基苯氧基聚乙氧基乙醇、聚乙二醇和辛基苯氧基聚乙氧基乙醇。

聚氧乙烯脱水山梨糖醇的脂肪酸酯如聚氧乙烯脱水山梨糖醇三油酸酯也是适用的。

优选的阴离子表面活性剂特别是烷基硫酸盐、烷基磺酸盐、烷基芳基磺酸盐、烷基化的磷酸，和它们的乙氧基化衍生物。其中的烷基基团通常有8-24个碳原子。

优选的非离子表面活性剂已知有下述商品名称的商品：

聚氧乙烯椰油烷基胺(如AMIET[®] 105 (Kao Co.))，聚氧乙烯油基胺(如AMIET[®] 415 (Kao Co.))，壬基苯酚聚乙氧基乙醇，聚氧乙烯硬脂基胺(AMIET[®] 320 (Kao Co.))，N-聚乙氧基乙胺(GENAMIN[®] (Hoechst

AG)), N, N, N', N' - 四(聚乙氧基聚丙氧基乙基)亚乙基二胺(如 TERRONIL[®] 和 TETRONIC[®] (BASF Wyandotte Corp.)), BRIJ[®] (Atlas Chemicals), ETHYLAN[®] CD和ETHYLAN[®] D (Diamond Shamrock), GENAPOL[®] C, GENAPOL[®] O, GENAPOL[®] S 和 GENAPOL[®] X080 (Hoechst AG), EMULGEN[®] 104P, EMULGEN[®] 109P 和 EMULGEN[®] 408 (Kao Co.); DISTY[®] 125 (Geronazzo), SOPROPHOR[®] CY 18 (Rhone Poulenc S.A.); NONISOL[®] (Ciba-Geigy), MRYJ[®] (ICI); TWEEN[®] (ICI); EMULSOGEN[®] (Hoechst AG); AMIDOX[®] (Stephan Chemical Co.), ETHOMID[®] (ArmaK Co.); PLURONIC[®] (BASF Wyandotte Corp.), SOPROPHOR[®] 461 P (Rhone Poulenc S.A.), SOPROPHOR[®] 496/P (Rhone Poulenc S.A.), ANTAROX FM-63 (Rhone Poulenc S.A.), SLYGARD 309 (Dow Corning), SILWET 408, SILWET L-7607N (Osi-Specialities).

阳离子表面活性剂特别是作为N-取代基至少有一个烷基基团有8-22个碳原子的季铵盐, 作为其它的取代基, 可以是卤代低级烷基、苄基或羟基-低级烷基基团。盐优选是卤化物、甲基硫酸盐或乙基硫酸盐的形式, 例如硬脂基三甲基铵氯化物或苄基二(2-氯乙基)乙基铵溴化物。

所用的油可以是矿物油或天然来源的油。天然油还可以是动物或植物来源的油。动物油中优选是牛油衍生物, 但也可以使用鱼油(如沙丁鱼油)和其衍生物。植物油大部分是各种来源的种子的油。可以提及的所用植物油的实例包括椰子油、菜籽油和葵花籽油和其衍生物。

在本发明的组合物中, 以喷雾混合物为基础, 油添加剂的浓度通常是0.01-2%。例如在制得喷雾混合物之后, 以所需的浓度向喷雾剂桶中加入油添加剂。

本发明组合物中, 优选的油添加剂包括植物来源的油, 例如菜籽油或葵花籽油, 植物来源的油的烷基酯如甲基衍生物, 或矿物油。

特别优选的油添加剂包括高级脂肪酸(C₈-C₂₂)的烷基酯, 特别是C₁₂-C₁₈脂肪酸的甲基衍生物, 例如月桂酸、棕榈酸和油酸的甲基酯。这些酯已知是月桂酸甲酯(CAS-111-82-0)、棕榈酸甲酯(CAS-1

12-39-0) 和油酸甲酯 (CAS-1 12-62-9)。

通过将油添加剂与表面活性物质结合使用可改进它们的施用和作用, 所述的表面活性物质例如是非离子表面活性剂、阴离子或阳离子表面活性剂。适当的阴离子、非离子或阳离子表面活性剂列于WO 97/34485的第7和8页。

优选的表面活性物质是十二烷基苄基磺酸盐类的阴离子表面活性剂, 特别是其钙盐, 和脂肪醇乙氧基化物类的非离子表面活性剂。特别优选的是乙氧基化的C₁₂-C₂₂ 脂肪醇, 其乙氧基化度为5 - 40。可以买到的优选表面活性剂的例子是Genapol类(Clariant AG, Muttenz, 瑞士)。

相对于添加剂总量而言, 表面活性物质的浓度通常是1-30重量%。

与表面活性剂组成油或矿物油或其衍生物的混合物的油添加剂的实例包括 Edenor ME SU[®], Emery 2231[®] (Henkel subsidiary Cognis GMBH, DE), Turbocharge[®] (Zeneca Agro, Stoney Creek, Ontario, CA), 或更特别的是 Actipron[®] (BP Oil UK Limited, GB)。

在油添加剂 / 表面活性剂混合物中加入有机溶剂有可能进一步提高其活性。适当的溶剂例如包括 Solvesso[®] (ESSO) 和 Aromatic Solvent[®] (Exxon 公司) 类的溶剂。

这些溶剂的浓度相对于总重量而言, 可以是10-80重量%。

在例如US-A-4834908中所述的这类油添加剂中, 对本发明组合物来说是特别优选的。更优选的油添加剂是已知其商品名称为MERGE[®], 可由BASF公司得到, 并且在US-A-4834908, 第5栏, 实施例COC-1中已有基本的描述。本发明中优选的其它油添加剂是SCORE[®] (Novartis Crop Protection Canada)。

在制剂和辅剂技术中通常所使用的表面活性剂, 油, 特别是植物油, 其衍生物如烷基化的脂肪酸和其混合物, 例如与阴离子表面活性剂如烷基化的磷酸、烷基硫酸盐与烷基芳基磺酸盐和高级脂肪酸的混合物, 在本发明组合物中以及在喷雾桶混溶液中也可以使用, 这些在下述文献中已有描述: 尤其是"《Mc Cutcheon's 洗涤剂 and 乳化剂年报》Mc

Cutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual" MC Publishing Corp. , Ridgewood New Jersey , 1998 ; Stache , H. , "Tensid-Taschenbuch", Carl Hanser Verlag, Munich/Vienna, 1990; M. 和 J. Ash, "《表面活性剂大全》Encyclopedia of Surfactants", 第 I-IV 卷, Chemical Publishing Co. , New York, 1981-89; G. Kapusta, "《除草剂助剂简编》A Compendium of Herbicide Adjuvants", Southern Illinois Univ. , 1998; L. Thomson Harvey, "《美国使用的农业喷雾助剂指南》A Guide to Agricultural Spray Adjuvants Used in the United States", Thomson Pubns. , 1992.

优选的剂型尤其具有下述的组成 (% = 重量百分数) 。

乳油:

活性成分混合物:	1-90 % , 优选5-20 %
表面活性剂:	1-30 % , 优选10-20 %
液体载体:	5-94 % , 优选70-85 %

粉剂:

活性成分混合物:	0.1-10 % , 优选0.1-5 %
固体载体:	99.9-90 % , 优选99.9-99 %

悬浮浓缩液:

活性成分混合物:	5-75 % , 优选10-50 %
水:	94-24 % , 优选88-30 %
表面活性剂:	1-40 % , 优选2-30 %

可湿性粉剂:

活性成分混合物:	0.5-90 % , 优选1-80 %
表面活性剂:	0.5-20 % , 优选1-15 %
固体载体:	5-95 % , 优选15-90 %

颗粒剂:

活性成分混合物: 0.1-30%, 优选0.1-15%

固体载体: 99.5-70%, 优选97-85%

下述实施例进一步说明了本发明, 但不限制本发明。

式I的除草剂与式X、XI、XII、XIII、XIV、XV、XVI、XVII、XVIII、XIX、XX、XXI、XXII、XXIII、XXIV、XXV、XXVI、XXVII、XXVIII或XXIX的安全剂的混合物的剂型实施例(% =重量百分数)

<u>F1 - 乳油</u>	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	5%	10%	25%	50%
十二烷基苯磺酸钙	6%	8%	6%	8%
蓖麻油聚乙二醇醚 (36 mol环氧乙烷)	4%	-	4%	4%
辛基苯酚聚乙二醇醚 (7-8 mol 环氧乙烷)	-	4%	-	2%
环己酮	-	-	10%	20%
芳族C ₉₋₁₂ 烃混合物	85%	78%	55%	16%

由上述浓缩液, 通过用水稀释可制备任何所需浓度的乳剂。

<u>F2. 乳油</u>	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	5%	10%	25%	50%
1-甲氧基-3-(3-甲氧基- 丙氧基)-丙烷	-	20%	20%	-
聚乙二醇(分子量400)	20%	10%	-	-
N-甲基-2-吡咯烷酮	-	-	30%	10%
芳族C ₉₋₁₂ 烃混合物	75%	60%	-	-

该溶液适用于以微滴的形式施用。

<u>F3. 可湿性粉剂</u>	a)	b)	c)	d)
------------------	----	----	----	----

活性成分混合物	5%	25%	50%	80%
木质素磺酸钠	4%	-	3%	-
月桂基硫酸钠	2%	3%	-	4%
二异丁基萘磺酸钠	-	6%	5%	6%
辛基苯酚聚乙二醇醚 (7-8 mol环氧乙烷)	-	1%	2%	-
高分散硅酸	1%	3%	5%	10%
高岭土	88%	62%	35%	-

将活性成分与助剂充分混合，混合物于适当的研磨机中充分研磨，得到可用水稀释的可湿性粉剂，稀释后可得到任何所需浓度的悬浮液。

F4. 包衣颗粒剂	a)	b)	c)
活性成分混合物	0.1%	5%	15%
高分散硅酸	0.9%	2%	2%
无机载体材料 (\bar{x} 0.1-1mm)	99.0%	93%	83%

例如CaCO₃ 或SiO₂

将活性成分溶解于二氯甲烷，将该溶液喷在载体上，然后真空蒸发溶剂。

F5. 包衣颗粒剂	a)	b)	c)
活性成分混合物	0.1%	5%	15%
聚乙二醇(分子量 200)	1.0%	2%	3%
高分散硅酸	0.9%	1%	2%
无机载体材料 (\bar{x} 0.1-1mm)	98.0%	92%	80%

例如CaCO₃ 或SiO₂

在混合器中，将经过经细研磨的活性成分均匀地施加到用聚乙二醇

湿润的载体材料上，得到无粉尘的包衣颗粒剂。

<u>F6. 挤出颗粒剂</u>	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	0.1%	3%	5%	15%
木质素磺酸钠	1.5%	2%	3%	4%
羧甲基纤维素	1.4%	2%	2%	2%
高岭土	97.0%	93%	90%	79%

将活性成分与助剂混合，研磨混合物，用水润湿，挤出，然后在空气中干燥。

<u>F7. 粉剂</u>	a)	b)	c)
活性成分混合物	0.1%	1%	5%
滑石	39.9%	49%	35%
高岭土	60.0%	50%	60%

将活性成分与载体混合，并在适当的研磨机中研磨该混合物，得到立即可用的粉剂。

<u>F8. 悬浮浓缩剂</u>	a)	b)	c)	d)
活性成分混合物	3%	10%	25%	50%
乙二醇	5%	5%	5%	5%
壬基苯酚聚乙二醇醚 (15mol环氧乙烷)	-	1%	2%	-
木质素磺酸钠	3%	3%	4%	5%
羧甲基纤维素	1%	1%	1%	1%
37%甲醛水溶液	0.2%	0.2%	0.2%	0.2%
硅油乳液	0.8%	0.8%	0.8%	0.8%
水	87%	79%	62%	38%

将经过精细研磨的活性成分与助剂充分混合，得到悬浮浓缩剂，通过用水稀释可得到任何所需浓度的悬浮液。

经常,更实用的是将式I的活性成分与式X, XI, XII, XIII, XIV, XV, XVI, XVII, XVIII, XIX, XX, XXI, XXII, XXIII, XXIV, XXV, XXVI, XXVII, XXVI II 或XXIX 的混合配伍成分分别加工成制剂,然后,在临使用之前将它们在施用设备中以所需的混合比制成“桶混混合物”的水剂形式。

式 X, XI, XII, XIII, XIV, XV, XVI, XVI I, XVI II, XIX, XX, XXI, XXII, XXII I, XXIV, XXV, XXVI, XXVII, XXVIII 或 XXIX安全剂保护种植植物不受式I除草剂植物毒性作用危害的能力在下面的实施例中予以说明。

生物试验 1: 安全作用

在温室条件下,试验植物在塑料盆中生长至4叶期。在此阶段,一方面在试验植物上仅施用除草剂,另一方面施用除草剂与欲试验作为安全剂的物质的混合物。试验物质以水悬浮剂的形式施用,该悬浮剂是由25%的可湿性粉剂制备(实施例 F3, b)),施用500升水/公顷。施用2至3周后,除草剂对栽培植物如玉米和禾谷类的毒性以百分数评价,100%是指植物已经死亡,0%是指没有植物毒性。

此试验的结果表明式X, XI, XII, XIII, XIV, XV, XVI, XVII, XVIII, XIX, XX, XXI, XXII, XXIII, XXIV, XXV, XXVI, XXVII, XXVIII或XXIX化合物可显著降低式I除草剂对种植植物的药害。这些结果的一些例子见下表B5。

表 B5: 本发明的除草剂和安全剂混合物的苗后作用:

试验植物	化合物编号 1.01 (60 g/ha)	化合物编号 1.01 (60 g/ha) + 化合物编号 11.03 (15 g/ha)
大麦	20	0
剪股颖属	70	70
看麦娘属	70	80
黑麦草属	70	70

由表B5可以看出,化合物编号No. 1.01对大麦的植物毒性为20%,这是不能允许的。剪股颖属、看麦娘属和黑麦草属杂草能够很好的被

防治。

与此相反,由No. 1.01的除草剂和No. 11.03的安全剂组成的混合物对种植植物没有植物毒性。与此同时,除草剂对草的作用不仅完全相同,而且令人惊奇的是,在看麦娘属的情况下,甚至有所增加(与只用除草剂No. 1.01达到的70%相比,它可达到80%)。

在把混合物按照实施例 F1、F2 和 F4-F8 加工制剂时可得到相同的结果。

将式I化合物与其它一些已知的除草剂混合是有利的。例如其结果是,在很多情况下除草谱更宽,对有用的植物选择性提高。尤其是,式I化合物与至少下述一种除草剂的混合物是重要的:

苯氧基-苯氧基丙酸类的除草剂,例如禾草灵,精吡氟禾草灵,精喹禾灵,噁草酯,炔草酯,氟氟草酯,精噁唑禾草灵,氟吡甲禾灵或氟吡乙禾灵;

羟胺类的除草剂,例如稀禾啉,禾草灭,烯草酮,噻草酮,酞肟草(tepralkoxydim),三甲苯草酮或丁氧环酮;

磺酰脲类的除草剂,例如磺氟黄隆,四唑嘧磺隆,苄嘧磺隆,氟嘧磺隆乙酯,醚磺隆,氟磺隆,氟嘧磺隆,环丙嘧磺隆,胺苯磺隆,乙氧嘧磺隆,fluazasulfuron,氟啶黄隆,唑吡嘧黄隆,iodosulfuron(CAS RN 144550-36-7和185119-76-0),甲磺隆,烟嘧磺隆,环丙氧黄隆,氟嘧磺隆,吡嘧黄隆,乙黄隆,砒嘧磺隆,噻吩磺隆,醚苯磺隆,苯磺隆,氟胺磺隆,氟磺隆,flucarbazone或tritosulfuron(CAS RN 142469-14-5);

咪唑啉酮类的除草剂,例如咪唑乙烟酸,咪草酸,imazamethapyr,咪唑啉酸,咪草啶酸或咪唑烟酸;

嘧啶类的除草剂,例如嘧草硫醚,肟啶草,双草醚;

三嗪类的除草剂,例如莠去津,西玛津,西草净,特丁净,特丁津;

脲类的除草剂,例如异丙隆,绿麦隆,敌草隆,杀草隆,氟草隆,利谷隆,甲基苯噻隆;

膦酸衍生物类的除草剂,例如草甘膦,草铵膦,草硫膦,phosphinothricin;

PPO类的除草剂, 例如硝基除草醚, 甲羧除草醚, 三氟羧草醚, 乳氟禾草灵, 乙氧氟草醚, ethoxyfen, 乙羧氟草醚, 氟磺胺草醚, 氟硝磺酰胺, 唑啉炔草 (CAS RN. -68049-83-2), benzfendizone (CAS RN 158755-95-4), butafenacil (US-A-5 183 492 中公开, CAS RN 158755-95-4), 氟酮唑草, cinidon-ethyl (CAS RN 142891-20-1), 氟烯草酸, 丙炔氟草胺, 达草氟, 炔丙噁唑草, 噁草酮, 戊噁唑草, 甲磺草胺, fluazolate (CAS RN 174514-07-9) 或氟唑草酯;

N-氯乙酰苯胺类的除草剂, 例如甲草胺, 乙草胺, 丁草胺, 二甲草胺, 二甲吩草胺, S-二甲吩草胺, 吡唑草胺, 异丙甲草胺, S-异丙甲草胺, 丙草胺, 毒草胺, 异丙草胺, 噻醚草胺或pethamid (CAS RN 106700-29-2);

苯氧基乙酸类的除草剂, 例如2,4-滴, 氯氟吡氧乙酸, MCPA, MCPP, MCPB, 三氯吡氧乙酸或精2甲4氯丙酸;

三嗪酮类的除草剂, 例如环嗪酮, 苯嗪草酮或嗪草酮;

二硝基苯胺类的除草剂, 例如氨磺乐灵, 二甲戊灵或氟乐灵;

哒嗪酮类的除草剂, 例如杀草敏或哒草伏;

氨基甲酸酯类的除草剂, 例如氯苯胺灵, 甜菜安, 甜菜宁或苯胺灵;

氧乙酰胺类的除草剂, 例如苯噻酰草胺或达草氟;

硫代氨基甲酸酯类的除草剂, 例如丁草敌, 环草敌, 燕麦敌, 茵草敌, 戊草丹, 禾草敌, 苜草丹, 禾草丹或野麦畏;

唑脲 (azoloureas) 类除草剂, 例如fentrazamide (CAS RN 158237-07-1) 或苯酮唑;

苯甲酸类除草剂, 例如麦草畏或氯氟吡啶酸;

N-酰基苯胺除草剂, 例如吡氟酰草胺, 或敌稗;

腈类除草剂, 例如溴苯腈, 敌草腈或碘苯腈;

三酮类除草剂, 例如磺草酮, mesotrione (由US-A-5 006 158已知), 异噁氟草或 isoxachlortole;

磺酰胺类除草剂, 例如 flucarbazone (CAS RN 181274-17-9), procarbazon (CAS RN 145026-81-9), chlorasulam, diclosulam (CAS RN 145701-21-9), florasulam, 阔草伏 (flumetsulam) 或 metosulam;

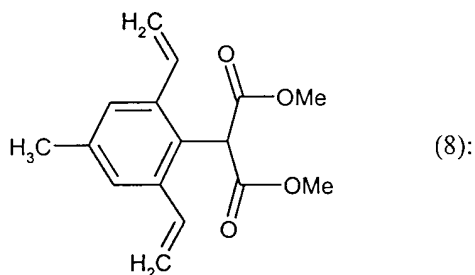
以及杀草强, 吡草黄, 灭草松, 环庚草醚, 异噁草松, chlopyralid, 野燕枯, 氟硫草定, 乙氧吡草黄, flurochloridone, indanofane, 异噁草胺, 噁嗪草酮 (CAS RN 153197-14-9), 吡草特, pyridafol (CAS RN 40020-01-7), 二氯喹啉酸, 氯甲喹啉酸, 灭草环或氟燕灵。

除非另有说明, 上述式I化合物的混合组分是已知的, 见《农药手册》The Pesticide Manual, 第11版, 1997, BCPC。如果需要, 上述式I化合物的混合组分也可以是酯或盐的形式, 如在《农药手册》, 第11版, 1997, BCPC中所述。

下面的实施例说明了本发明, 但不构成任何限制。

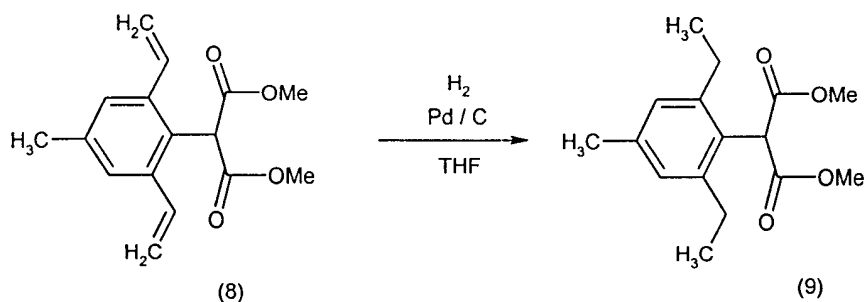
制备实施例

实施例 P1: 制备下述化合物:



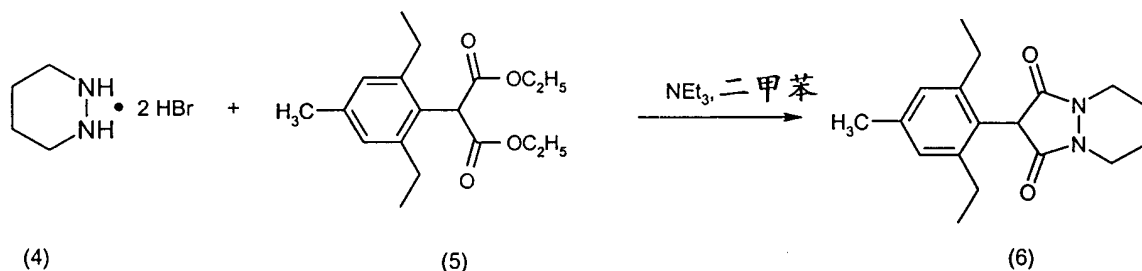
在 20g 的 2-(2,6-二溴-4-甲基-苯基)-丙二酸二甲酯 (52.6 mmol) 的 400ml 甲苯溶液中 (脱气 3 次, 真空/氩气), 先加入 36.7g (0.116 mol) 三丁基乙烯基锡烷, 然后加入 2g 四(三苯膦)合钯。然后于 90 至 95℃ 搅拌反应混合物 9 小时。用 Hyflo 过滤, 旋转蒸发器浓缩, 色谱纯化, 得到 15.3g (8), 是黄色的油状物, 该化合物可直接用于下一步反应, 而无需进一步纯化。

实施例 P2:



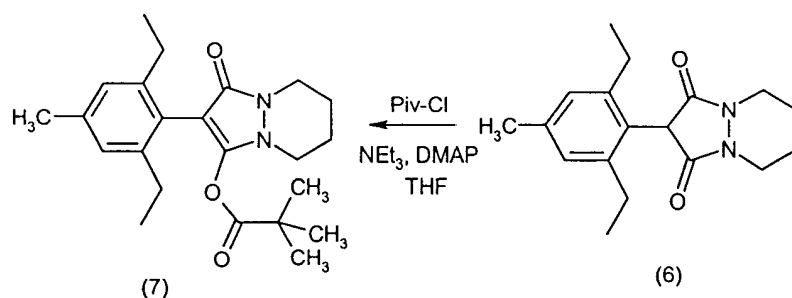
将实施例P1得到的15.2 g 化合物(8)用氢氢化, 反应使用钯催化剂(以碳为载体, 7g的5% Pd/C), 在160ml四氢呋喃中于20至25℃下进行。氢化完成后, 通过Hyflo过滤出产物, 旋转蒸发器蒸发, 得到13.7 g 化合物(9), 为黄色结晶, 熔点47- 49℃。

实施例 P3:



将71.8 g (0.71 mol) 三乙胺加入到40g (0.15 mol) (4) 于1000 ml 二甲苯中的悬浮液中, 使混合物脱气(4次, 真空/氩气)。然后将黄色的悬浮液加热至60℃, 搅拌3小时。接着向其中加入 42.5g(0.15mol) (5), 为了蒸出过量的三乙胺和产生的乙醇, 混合物加热至150℃的浴温。3小时后, 将反应混合物冷却至40℃, 倒入500ml 冰/水混合物中。用100ml的1N氢氧化钠水溶液使反应混合物碱化, 水相(含有产物)用乙酸乙酯洗涤二次。有机相用1N 氢氧化钠溶液洗涤二次之后, 合并水相, 蒸除残留的二甲苯, 合并的水相在冷却下用4NHCl调节pH至2-3。将沉淀的产物倾入抽滤过滤器, 过滤的残余物用水和少量己烷洗涤, 于60℃用P₂O₅真空干燥, 得到34.6g (6), 为浅褐色固体, 熔点242- 244℃(分解)。

实施例 P4:



冷却至0℃, 在3g (10.4 mmol) 的(6)和1.6 g (15.8 mmol) 三乙

胺于100ml四氢呋喃溶液中加入催化剂量的4-二甲氨基吡啶，然后向其中滴加1.57g(13.0 mmol)新戊酰氯。于0℃拌30分钟后，移去冷却源，继续搅拌60分钟。然后将反应混合物倒入饱和氯化钠水溶液中，分离出有机相，有机相用硫酸镁干燥，过滤和蒸发浓缩。在用色谱纯化和用乙醚重结晶后，得到2.94g (7)，熔点135-136⁰C。

实施例P5: 制备2-(2,6-二乙基-4-甲基-苯基)-四氢-吡唑并[1,2-a]哒嗪-1,3-二酮:

在20℃，将1.39 g 四氢-吡唑并[1,2-a]哒嗪-1,3-二酮和2.68 g 叔丁醇钠溶于20 ml 二甲基甲酰胺，向其中加入3.21g 2,6-二乙基-4-甲基-碘代苯和0.82g Pd(TPP)₂Cl₂，然后在125℃搅拌2.5小时。冷却至室温后，加入200ml乙酸乙酯和200ml乙醚，将反应混合物倾入抽滤过滤器中。在过滤残余物中加入 100ml 水和100ml二氯甲烷，用盐酸酸化。分离有机相，干燥和蒸发浓缩。

残余物(1.9 g)用硅胶色谱纯化(乙酸乙酯/己烷 3:1)。得到2-(2,6-二乙基-4-甲基-苯基)-四氢-吡唑并[1,2-a]哒嗪-1,3-二酮，为灰褐色结晶，熔点174-175℃。

实施例 P6: 2-(2,6-二乙基-4-甲基-苯基)-四氢-吡唑并[1,2-a]哒嗪-1,3-二酮:

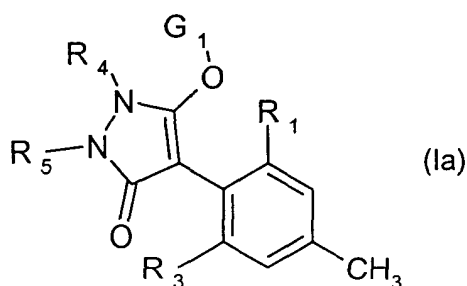
在20℃，将1.39 g 四氢-吡唑并[1,2-a]哒嗪-1,3-二酮和2.68 g 叔丁醇钠溶于20 ml 二甲基甲酰胺，向其中加入2.66g 2,6-二乙基-4-甲基-溴代苯和0.82g Pd(TPP)₂Cl₂，然后在125℃搅拌2.5小时。冷却至室温后，加入200ml乙酸乙酯和200ml乙醚，将反应混合物倾入抽滤过滤器中。在过滤残余物中加入 100ml 水和100ml二氯甲烷，用盐酸酸化。分离有机相，干燥和蒸发浓缩。

残余物(1.4 g)用硅胶色谱纯化(乙酸乙酯/己烷 3:1)。得到2-(2,6-二乙基-4-甲基-苯基)-四氢-吡唑并[1,2-a]哒嗪-1,3-二酮，为灰褐色结晶，熔点174-175℃。

在下表中，熔点以℃表示，Me表示甲基基团。其中给出了取代基 $G_1 - G_{10}$ 和 R_4 和 R_5 (各自独立)的结构式，结构式左侧是与杂环 $Q_1 - Q_{10}$ 的氧原子的连接点。在 R_4 和 R_5 一起表示取代基含义的情况下，结构式右侧是与杂环 Q_1 的连接点，其余末端价键是甲基。

下表中，“LC/MS: M⁺”以道尔顿表示分析中通过耦合 HPLC (高效液相色谱)和 MS (质谱)仪确定的产物的正电荷分子离子。

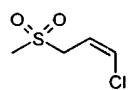
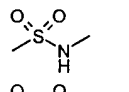
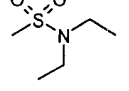
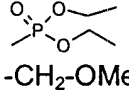
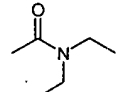
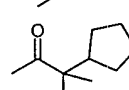
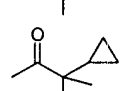
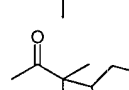
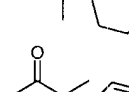
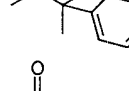
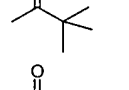
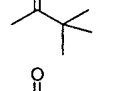
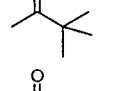

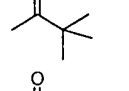

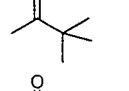
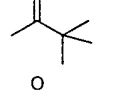

表 1: 式 Ia 化合物:



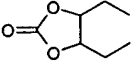
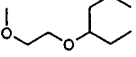
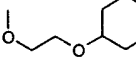

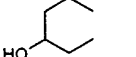
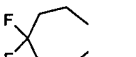
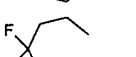

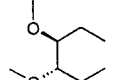
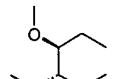

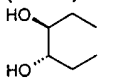

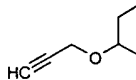
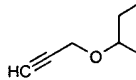

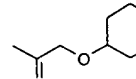
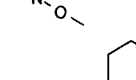

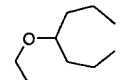

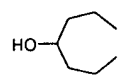


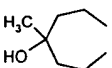
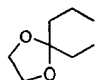
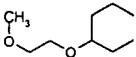
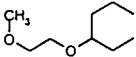

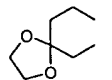

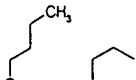
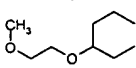
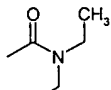
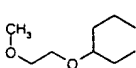
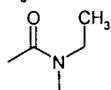
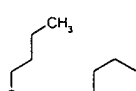

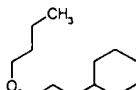
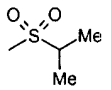
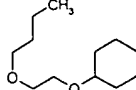
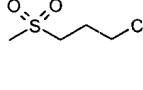
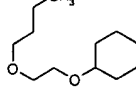

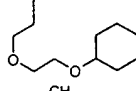
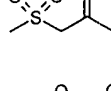
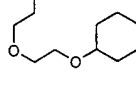
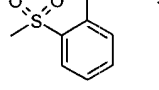
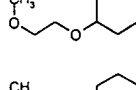
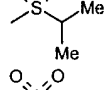
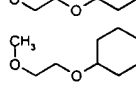
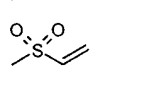
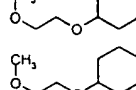


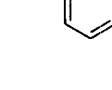


编号	R_1	R_3	R_4/R_5	G_1	物理数据
1.1	乙基	乙基	$-(CH_2)_4-$	-H	M.p. 209-211
1.2	乙基	乙基	$-(CH_2)_4-$		M.p. 125-127
1.3	乙基	乙基			M.p. 195
1.4	乙基	乙基			M.p. 180
1.5	乙基	乙基		-H	蜡状
1.6	乙基	乙基			固体
1.1	乙基	乙基			结晶
1.2	乙基	乙基		-H	结晶
1.3	乙基	乙基		-H	固体
1.4	乙基	乙基		-H	固体
1.5	乙基	乙基		-H	固体
1.6	乙基	乙基			M.p. 153-155

编号	R ₁	R ₃	R ₄ /R ₅	G ₁	物理数据
1.7	乙基	乙基			油状物
1.8	乙基	乙基			油状物
1.9	乙基	乙基			固体
1.10	乙基	乙基		-H	固体
1.11	乙基	乙基		-H	粘稠物
1.12	乙基	乙基		-H	粘稠物
1.13	乙基	乙基		-H	粘稠物
1.14	乙基	乙基		-H	粘稠物
1.15	乙基	乙基		-H	粘稠物
1.16	乙基	乙基			粘稠物
1.17	乙基	乙基		-H	粘稠物
1.18	乙基	乙基		-H	固体
1.19	乙基	乙基		-H	固体
1.20	乙基	乙基			固体
1.21	乙基	乙基			油状物
1.22	乙基	乙基			粘稠物
1.23	乙基	乙基		-H	粘稠物
1.24	乙基	乙基		-H	粘稠物
1.25	乙基	乙基			粘稠物
1.26	乙基	乙基		-H	粘稠物
1.27	乙基	乙基		-H	固体
1.28	乙基	乙基			固体
1.29	乙基	乙基		-H	结晶
1.30	乙基	乙基		-H	蜡状

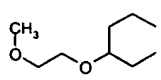
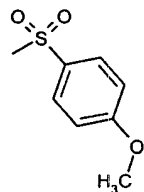
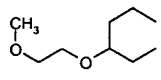
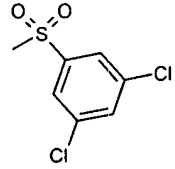
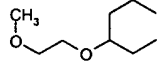
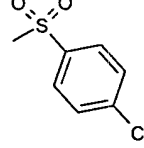
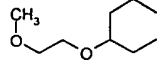
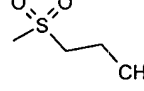
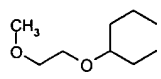
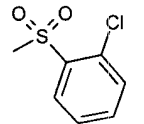
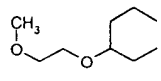
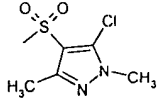
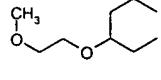
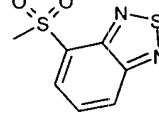
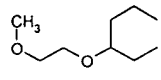
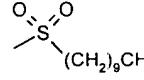
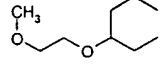
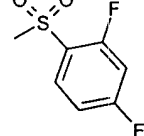
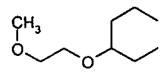
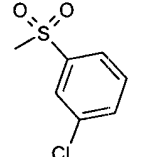
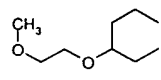
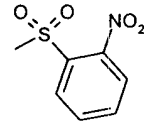
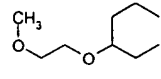
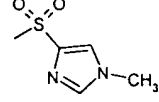
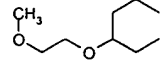
编号	R ₁	R ₃	R ₄ /R ₅	G ₁	物理数据
1.31	乙基	乙基			粘稠物
1.32	乙基	乙基			粘稠物
1.33	乙基	乙基		-H	固体
1.34	乙基	乙基			蜡状
1.35	乙基	乙基		-H	非晶物
1.36	乙基	乙基		-H	蜡状
1.37	乙基	乙基			油状物
1.38	乙基	乙基		-H	结晶
1.39	乙基	乙基		-H	固体
1.40	乙基	乙基			固体
1.41	乙基	乙基		-H	M.p. 283
1.42	乙基	乙基		-H	M.p. 227
1.43	乙基	乙基			M.p.122-124
1.44	乙基	乙基		-H	M.p. 148-151
1.45	乙基	乙炔基		-H	M.p. 163-166
1.46	乙基	乙炔基			M.p. 114-116
1.47	乙基	乙基		-H	固体
1.48	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.49	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.50	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.51	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.52	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.53	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.54	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		

编号	R ₁	R ₃	R ₄ /R ₅	G ₁	物理数据
1.55	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.56	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.57	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.58	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.59	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -	-CH ₂ -OMe	
1.60	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -	-CH ₂ -SMe	
1.61	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.62	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.63	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.64	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.65	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.66	MeO-	乙基	-(CH ₂) ₄ -		M.p. 143-144°C
1.67	乙基-	乙炔基	-(CH ₂) ₄ -		
1.68	-OCHF ₂	乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.69	-CHO	乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.70		乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.71		乙基	-(CH ₂) ₄ -		
1.72	MeO-	MeO-	-(CH ₂) ₄		
1.73	MeO-	乙基	-(CH ₂) ₄ -	-H	M.p. 159 – 161°C
1.74	乙基-	乙炔基	-(CH ₂) ₄ -	-H	
1.75	-OCHF ₂	乙基	-(CH ₂) ₄ -	-H	
1.76	-CHO	乙基	-(CH ₂) ₄ -	-H	
1.77		乙基	-(CH ₂) ₄ -	-H	

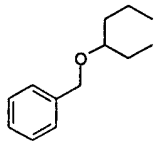
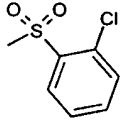
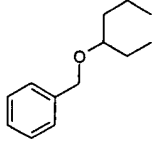
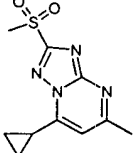
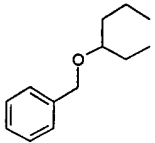
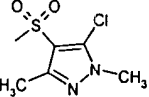
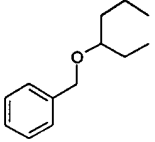
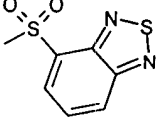
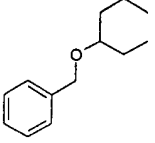
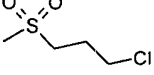
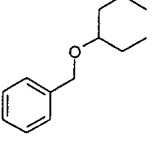
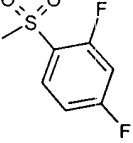
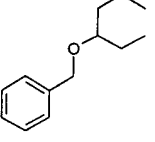
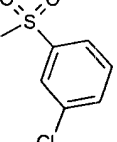
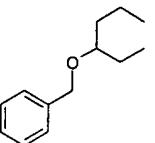
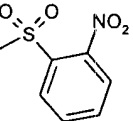
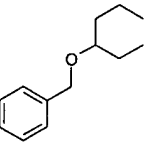
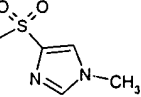
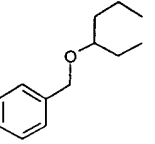
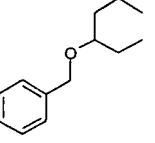
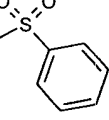
编号	R ₁	R ₃	R ₄ /R ₅	G ₁	物理数据
1.78		乙基	-(CH ₂) ₄ -	-H	
1.79	MeO-	MeO-	-(CH ₂) ₄ -	-H	
1.80	MeO-	乙基	-(CH ₂) ₄ -	-CO ₂ C ₂ H ₅	M.p. 112-113°C
1.81	乙基	乙基		-H	M.p. 283°C (分解)
1.82	乙基	乙基		-H	M.p. 140°C
1.83	MeO-	乙基		-H	固体
1.84	MeO-	乙基			蜡状
1.85	MeO-	乙基		-H	M.p. 177-180°C
1.86	MeO-	乙基		-H	M.p. 208-210°C
1.87	MeO-	乙基			M.p. 102-104°C
1.88	乙基	乙基		-H	M.p. 193-194°C
1.89	乙基	乙基	(反式) 		M.p. 163-165°C
1.90	乙基	乙基	(反式) 		固体
1.91	乙基	乙基		-H	蜡状
1.92	乙基	乙基			蜡状
1.93	乙基	乙基		-H	蜡状
1.94	乙基	乙基			蜡状
1.95	乙基	乙基			粘稠物
1.96	乙基	乙基		-H	M.p. 200-202°C

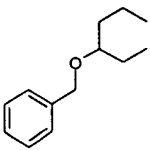
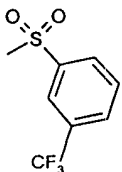
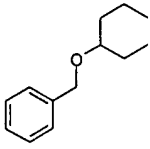
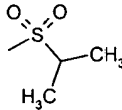
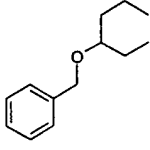
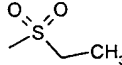
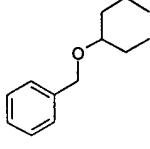
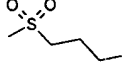
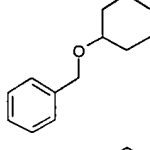
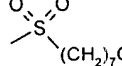
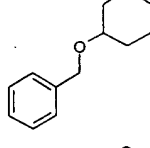
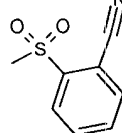
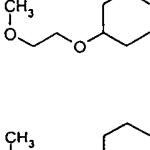
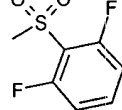
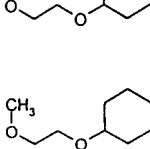
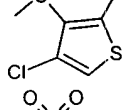
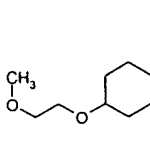
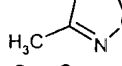
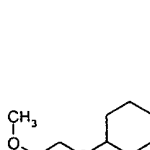
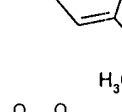
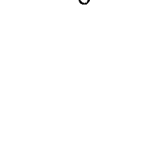
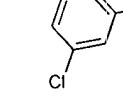
编号	R ₁	R ₃	R ₄ /R ₅	G ₁	物理数据
1.97	乙基	乙基		-H	M.p. 210-220°C (分解)
1.98	乙基	乙基		-H	固体
1.99	乙基	乙炔基		-H	蜡状
1.100	乙基	乙炔基			蜡状
1.101	乙基	乙基			粘稠物
1.102	乙基	乙基		-H	蜡状
1.103	OCH ₃	乙基			蜡状
1.104	乙基	乙基			蜡状
1.105	乙基	乙基			蜡状
1.106	乙基	乙基			蜡状
1.107	乙基	乙基			蜡状
1.108	乙基	乙基			蜡状
1.109	乙基	乙基			蜡状
1.110	乙基	乙基			蜡状
1.111	乙炔基	乙基			蜡状
1.112	乙炔基	乙基			蜡状
1.113	乙炔基	乙基			蜡状
1.114	乙炔基	乙基			蜡状
1.115	乙炔基	乙基			蜡状

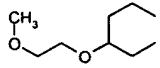
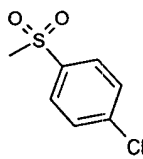
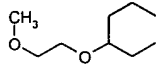
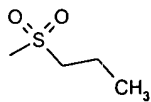
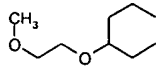
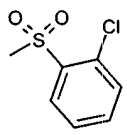
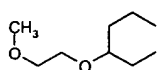
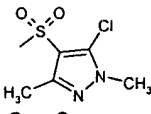
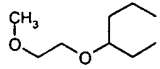
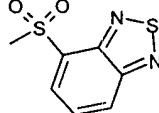
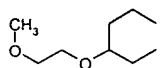
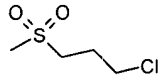
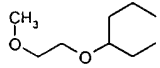
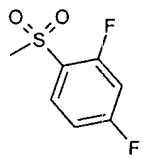
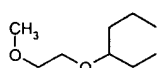
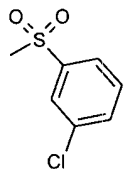
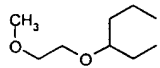
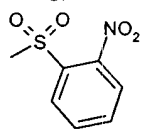
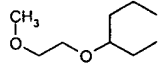
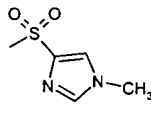
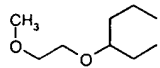
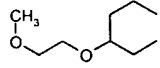
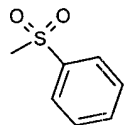
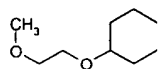
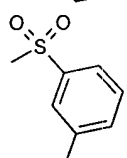
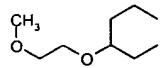
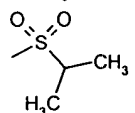
编号	R ₁	R ₃	R ₄ /R ₅	G ₁	物理数据
1.116	乙基	乙基		-H	蜡状
1.117	乙基	乙基		-H	蜡状
1.118	乙基	乙炔基		-H	蜡状
1.119	乙基	乙炔基		-H	蜡状
1.120	OCH ₃	乙基		-H	M.p. 130-136°C
1.121	OCH ₃	乙基		-H	M.p. 198-200°C
1.122	乙基	乙基			蜡状
1.123	乙基	OCH ₃			蜡状
1.124	乙炔基	乙基			蜡状
1.125	乙炔基	乙基			蜡状
1.126	乙炔基	乙基			蜡状
1.127	乙基	乙基		-H	
1.128	乙基	乙基			
1.129	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =552)
1.130	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =590)
1.131	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =535)

编号	R ₁	R ₃	R ₄ /R ₅	G ₁	物理数据
1.132	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =546)
1.133	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =584)
1.134	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =550)
1.135	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =482)
1.136	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =550)
1.137	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =568)
1.138	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =574)
1.139	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =580)
1.140	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =552)
1.141	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =550)
1.142	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =561)
1.143	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =520)
1.144	OCH ₃	乙基		-S(O) ₂ CH ₃	蜡状 (LC/MS: M ⁺ =454)

编号	R ₁	R ₃	R ₄ /R ₅	G ₁	物理数据
1.145	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =516)
1.146	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =584)
1.147	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =468)
1.148	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =496)
1.149	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =552)
1.150	OCH ₃	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =541)
1.151	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =582)
1.152	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =620)
1.153	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =565)
1.154	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =576)
1.155	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =614)
1.156	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =580)
1.157	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =512)

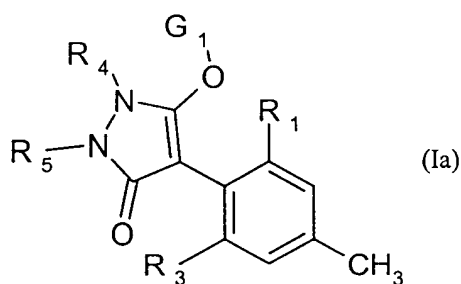
编号	R ₁	R ₃	R ₄ /R ₅	G ₁	物理数据
1.158	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =580)
1.159	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =642)
1.160	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =598)
1.161	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =604)
1.162	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =546)
1.163	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =582)
1.164	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =580)
1.165	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =591)
1.166	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =550)
1.167	乙基	乙基		-S(O) ₂ CH ₃	蜡状 (LC/MS: M ⁺ =484)
1.168	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =546)

编号	R ₁	R ₃	R ₄ /R ₅	G ₁	物理数据
1.169	乙基	乙基			物理数据 蜡状 (LC/MS: M ⁺ =614)
1.170	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =512)
1.171	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =498)
1.172	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =526)
1.173	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =582)
1.174	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =571)
1.175	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =550)
1.176	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =588)
1.177	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =533)
1.178	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =544)
1.179	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =582)

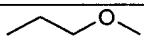















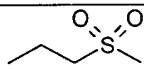
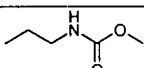
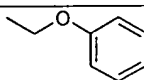
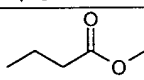
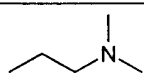
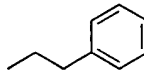
编号	R ₁	R ₃	R ₄ /R ₅	G ₁	物理数据
1.180	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =548)
1.181	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =480)
1.182	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =548)
1.183	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =566)
1.184	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =572)
1.185	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =514)
1.186	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =550)
1.187	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =548)
1.188	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =559)
1.189	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =518)
1.190	乙基	乙基		-S(O) ₂ CH ₃	蜡状 (LC/MS: M ⁺ =452)
1.191	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =514)
1.192	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =582)
1.193	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =480)

编号	R ₁	R ₃	R ₄ /R ₅	G ₁	物理数据
1.194	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =466)
1.195	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =494)
1.196	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =550)
1.197	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =539)
1.198	乙基	乙基			蜡状 (LC/MS: M ⁺ =572)
1.199	OCH ₃	OCH ₃	-(CH ₂) ₄ -	-H	M.p. 180-193°C
1.200	乙基	乙基		-CO ₂ C ₂ H ₅	M.p. 153-154°C

表 2: 式 Ia 化合物:

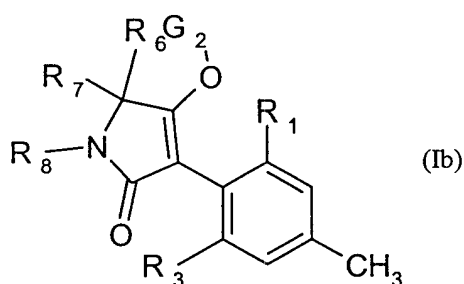






编号	R ₁	R ₃	R ₄	R ₅	G ₁	物理数据
2.01	乙基	乙基	甲基		-H	蜡状
2.02	乙基	乙基	甲基		-H	固体
2.03	乙基	乙基	甲基		-H	固体
2.04	乙基	乙基	甲基			蜡状
2.05	乙基	乙基	甲基			蜡状
2.06	乙基	乙基			-H	M.p. 171-172
2.07	乙基	乙基				蜡状
2.08	乙基	乙基			-H	非晶物

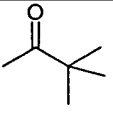
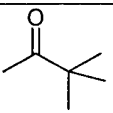
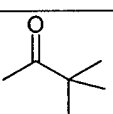
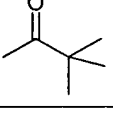
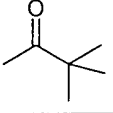
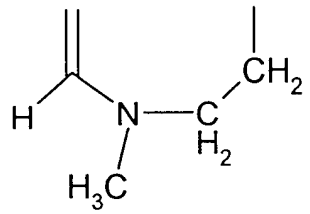
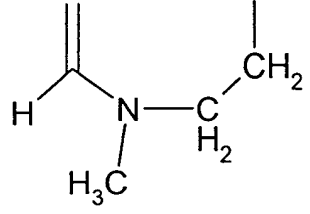
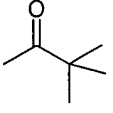
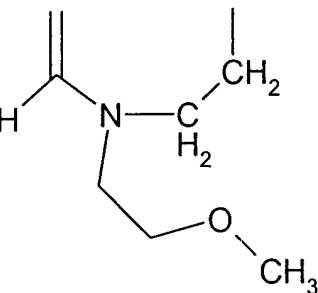
编号	R ₁	R ₃	R ₄	R ₅	G ₁	物理数据
2.09	乙基	乙基				非晶物
2.10	乙基	乙基			-H	
2.11	乙基	乙基	甲基	甲基		
2.12	乙基	乙基	甲基	甲基	-SO ₂ CH ₃	
2.13	乙基	MeO-	甲基	甲基		
2.14	乙基	乙炔基	甲基	甲基		
2.15	乙基	乙基	甲基	-苯基		
2.16	乙基	乙基	甲基	-3-吡啶基		
2.17	乙基	乙基	甲基	-2-噻吩基		
2.18	乙基	乙基	甲基	-烯丙基		
2.19	乙基	乙基	甲基	-丁烯基		
2.20	乙基	乙基	甲基	-4-氯-苯基		
2.21	MeO-	MeO-	甲基	烯丙基	-H	
2.22	乙炔基	乙基	苯基-	苯基	-H	
2.23	乙炔基	乙基	苯基		-H	
2.24	乙基	乙基		甲基-	-H	
2.25	乙基	乙基		甲基-	-H	
2.26	乙基	乙基	苯基		-H	
2.27	乙基	乙基		甲基-	-H	
2.28	乙基	乙基	-苄基	甲基-	-H	
2.29	乙基	乙基		甲基-	-H	
2.30	乙基	乙基		甲基-	-H	
2.31	乙基	乙基		甲基-	-H	

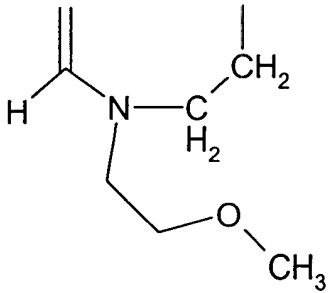
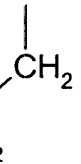
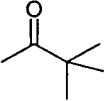
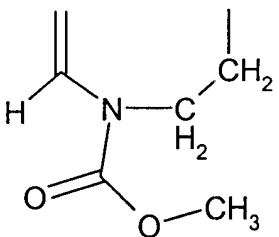
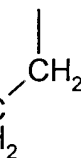
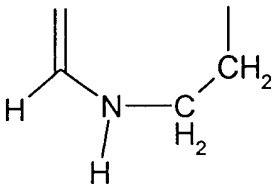
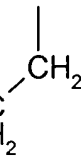
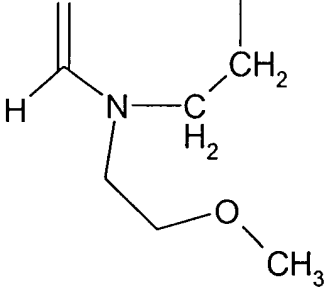
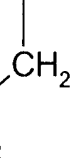
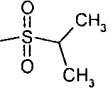
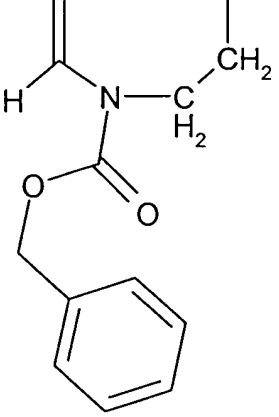
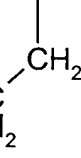
编号	R ₁	R ₃	R ₄	R ₅	G ₁	物理数据
2.32	乙基	乙基	-(CH ₂) ₂ OH	烯丙基	-H	M.p. 180-185°C (分解)

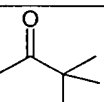
表 3: 式 Ib 化合物:



编号	R ₁	R ₃	R ₆	R ₇	R ₈	G ₂	物理数据
3.01	乙基	乙基	-Me	-Me	-Me	-H	M.p. 249-254°C
3.02	乙基	乙基	-Me	-H	-Me	-H	
3.03	乙基	乙基	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	-	-Me	-H	
3.04	乙炔基	乙基	-CH ₂ -CH ₂ -	-	-烯丙基	-H	
3.05	乙基	乙基	-CH ₂ -C(Cl) ₂ -	-	-Me		
3.06	乙基	乙基	-(CH ₂) ₂ -	-	-Me	-H	
3.07	乙基	乙基	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -	-	-Me	-H	
3.08	乙基	乙基	-(CH ₂) ₂ -C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -	-	-Me	-H	
3.09	乙炔基	乙基	-(CH ₂) ₄ -	-	-Me	-H	
3.10	MeO-	乙基	-(CH ₂) ₂ -	-	-H	-H	
3.11	MeO-	乙基	-(CH ₂) ₂ -	-	-甲基		
3.12	-C(O)CH ₃	乙基	-(CH ₂) ₂ -	-	甲基	-H	
3.13	-OCHF ₂	乙基	-(CH ₂) ₂ -	-	甲基		
3.14	乙基	乙基	-(CH ₂) ₃ -	-	甲基		
3.15	乙基	乙基	-(CH ₂) ₅ -	-	-H	-H	M.p. 222-224°C

编号	R ₁	R ₃	R ₆	R ₇	R ₈	G ₂	物理数据
3.16	乙基	乙基	-(CH ₂) ₅ -		-H		M.p. 147-149°C
3.17	乙基	乙基	甲基	甲基	-H	-H	M.p. 244-246°C
3.18	乙基	乙基	甲基	甲基	-H		M.p. 164-166°C
3.19	乙基	乙基	-(CH ₂) ₅ -		- <i>n</i> -C ₄ H ₉	-H	M.p. 170-175°C
3.20	乙基	乙基	-(CH ₂) ₅ -		- <i>n</i> -C ₄ H ₉		M.p. 99-101°C
3.21	乙基	乙基	-(CH ₂) ₅ -		C ₃ H ₆ OMe	-H	固体
3.22	乙基	乙基	甲基	甲基	甲基		M.p. 94-101°C
3.23	乙基	乙基	-(CH ₂) ₅ -		甲基	-H	M.p. 252-262°C
3.24	乙基	乙基	-(CH ₂) ₅ -		甲基		M.p. 127-128°C
3.25	乙基	乙基				-H	结晶
3.26	乙基	乙基					蜡状
3.27	乙基	乙基				-H	结晶

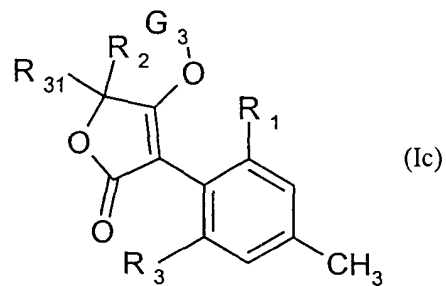
编号	R ₁	R ₃	R ₆	R ₇	R ₈	G ₂	物理数据
3.28	乙基	乙基					结晶
3.29	乙基	乙基				-H	固体
3.30	乙基	乙基				-H	固体
3.31	乙基	乙基					
3.32	乙基	乙基				-H	非晶物

编号	R ₁	R ₃	R ₇	R ₆	R ₈	G ₂	物理数据
3.33	乙基	乙基	甲基		-(CH ₂) ₄ -		

编号	R ₁	R ₃	R ₇	R ₆	R ₈	G ₂	物理数据
3.34	乙基	乙基	甲基	$-(\text{CH}_2)_3-$			
3.35	乙基	乙基	-H			-H	
3.36	乙基	乙基	-H				
3.37	乙基	乙基	-H				
3.38	乙基	乙基	-H			-H	
3.39	乙基	乙基	-H				
3.40	乙基	乙基	-H			-H	

编号	R ₁	R ₃	R ₇	R ₆	R ₈	G ₂	物理数据
3.41	乙基	乙基	-H				
3.42	乙基	乙基	-H			-H	
3.43	乙基	乙基	-H				
3.44	乙基	乙基	-H			-H	
3.45	乙基	乙基	-H				

表 4: 式 Ic 化合物:












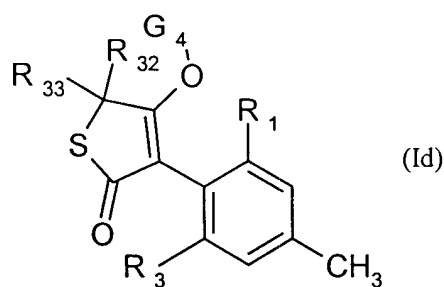
编号	R ₁	R ₃	R ₂	R ₃₁	G ₃	物理数据
4.01	乙基	乙基	甲基	甲基	-H	M.p. 224-226°C
4.02	乙基	乙基	甲基	甲基		M.p. 102-104°C
4.03	乙基	乙基	甲基	乙基	-H	
4.04	乙基	乙炔基	甲基	甲基	-H	
4.05	乙基	乙炔基	甲基	甲基		
4.06	乙基	甲氧基	甲基	甲基	-H	
4.07	乙基	乙基	-(CH ₂) ₂ -		-H	
4.08	乙基	乙基	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -			
4.09	乙基	乙基	-(CH ₂) ₂ -C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -			
4.10	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		-H	
4.11	乙基	乙基	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -			
4.12	乙基	乙基	甲基	异丙基	-H	
4.13	乙基	乙基	甲基	乙基	-H	
4.14	乙基	乙基	甲基	正丁基		
4.15	乙基	乙基	甲基	H		
4.16	乙基	乙基	-H	-H	-H	M.p. 176-178°C
4.17	乙基	乙基	-H	-H		M.p. 80-82°C
4.18	OCH ₃	乙基	-H	-H	-H	M.p. 169-171°C
4.19	OCH ₃	乙基	-H	-H		油状物

表 5: 式 Id 化合物:











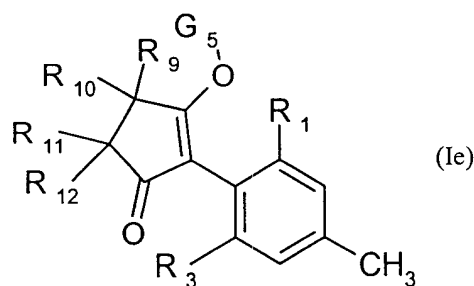


编号	R ₁	R ₃	R ₃₂	R ₃₃	G ₄	物理数据
5.01	乙基	乙基	甲基	甲基	-H	M.p. 181-183°C
5.02	乙基	乙基	甲基	甲基		油状物
5.03	乙基	乙基	甲基	乙基	-H	
5.04	乙基	乙炔基	甲基	甲基	-H	
5.05	乙基	乙炔基	甲基	甲基		
5.06	乙基	甲氧基	甲基	甲基	-H	
5.07	乙基	乙基	-(CH ₂) ₂ -		-H	
5.08	乙基	乙基	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -			
5.09	乙基	乙基	-(CH ₂) ₂ -C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -			
5.10	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -			
5.11	乙基	乙基	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -			
5.12	乙基	乙基	甲基	异丙基	-H	
5.13	乙基	乙基	甲基	乙基	-H	
5.14	乙基	乙基	甲基	正丁基		
5.15	乙基	乙基	甲基	H		
5.16	乙基	乙基	甲基	H	-H	油状物

表 6: 式 Ie 化合物:



编号	R ₁	R ₃	R ₉	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	G ₅	物理数据
6.01	乙基	乙基	甲基	-H	甲基	-H		
6.02	乙基	乙基	甲基	甲基	-H	-H		
6.03	乙基	乙基	-(CH ₂) ₂ -		-H	-H	-H	








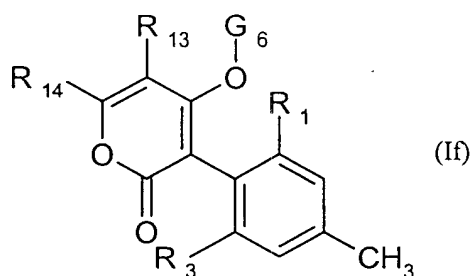
编号	R ₁	R ₃	R ₉	R ₁₀	R ₁₁	R ₁₂	G ₅	物理数据
6.04	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		甲基	-H	-H	
6.05	乙基	乙基	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		-H	-H		
6.06	乙基	乙基	-H	甲基	-(CH ₂) ₄ -			
6.07	乙基	乙基	-H	-O-		-H		
6.08	乙基	乙基	-H	-CH ₂ -		-H		
6.09	乙基	乙炔基	-H	-(CH ₂) ₃ -		-H		
6.10	乙基	MeO-	-H	-(CH ₂) ₄ -		-H		
6.11	乙基	乙炔基	-H	-(CH ₂) ₄ -		-H		

表 7: 式 If 化合物:




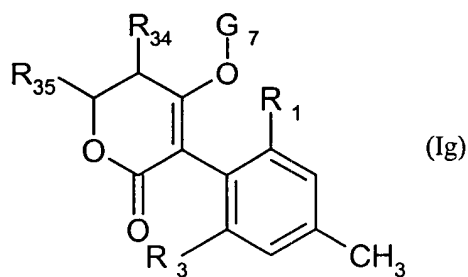
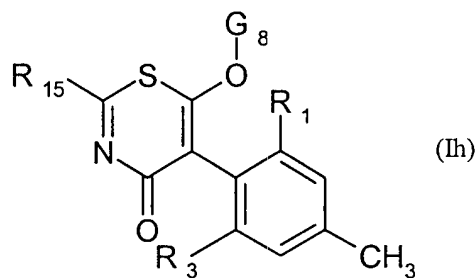
编号	R ₁	R ₂	R ₁₃	R ₁₄	G ₆	物理数据
7.01	乙基	乙基	甲基	甲基	-H	
7.02	乙基	乙基	甲基	-H	-H	
7.03	乙基	乙基	-H	甲基	-H	
7.04	乙基	乙基	乙基	甲基	-H	
7.05	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -		-H	
7.06	乙基	MeO-	-(CH ₂) ₄ -		-H	
7.07	乙基	乙炔基	-(CH ₂) ₄ -			
7.08	乙基	乙炔基	-(CH ₂) ₃ -		-H	

表 8: 式 Ig 化合物:



编号	R ₁	R ₂	R ₃₄	R ₃₅	G ₇	物理数据
8.01	乙基	乙基	甲基	甲基	-H	
8.02	乙基	乙基	甲基	-H	-H	
8.03	乙基	乙基	-H	甲基	-H	
8.04	乙基	乙基	乙基	甲基	-H	
8.05	乙基	乙基	-(CH ₂) ₄ -			
8.06	乙基	乙基	-(CH ₂) ₃ -			
8.07	乙基	乙炔基	甲基	甲基		
8.08	乙基	甲氧基	甲基	甲基		

表 9: 式 Ih 化合物:



编号	R ₁	R ₃	R ₁₅	G ₈	物理数据
9.01	乙基	乙基	甲基	-H	
9.02	乙基	甲氧基	苯基	-H	
9.03	乙基	乙炔基	-4-氯苯基	-H	
9.04	乙基	乙基	乙基		
9.05	乙基	乙基	-OMe		
9.06	乙基	乙基	-CF ₃		




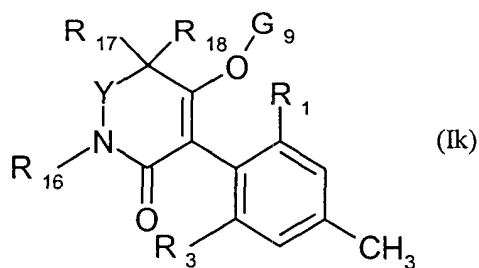



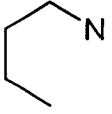






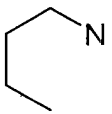
编号	R ₁	R ₃	R ₁₅	G ₈	物理数据
9.07	乙基	乙基	异丙基		
9.08	乙基	乙基	正丁基		
9.09	乙基	乙基	环丙基		
9.10	乙基	乙基	苯基	-H	M.p. 208-209°C
9.11	乙基	乙基	苯基		M.p. 147-149°C
9.12	乙基	乙基	-4-叔丁基-苯基	-H	M.p. 222-224°C
9.13	乙基	乙基	-4-叔丁基苯基		非晶物
9.14	乙基	乙基	-4-甲苯基	-H	
9.15	乙基	乙基	-4-甲苯基		
9.16	乙基	乙基	-3-氯-4-氟-苯基	-H	M.p. 186-188°C
9.17	乙基	乙基	-3-氯-4-氟-苯基		M.p. 109-110°C

表 10: 式 Ik 化合物:

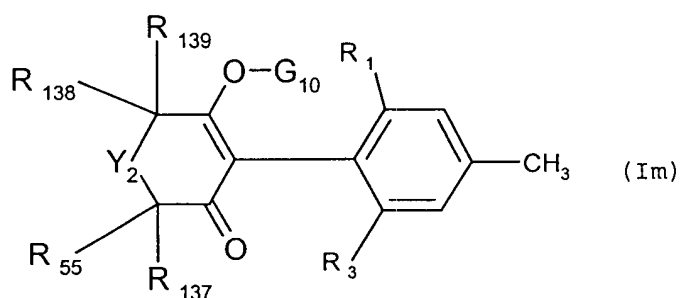


编号	R ₁	R ₃	R ₁₆	Y	R ₁₇	R ₁₈	G ₉	物理数据
10.01	乙基	乙基	甲基	O	甲基	-H		
10.02	乙基	乙基	甲基	O	甲基	甲基		
10.03	乙基	乙基	甲基	N-CH ₃	甲基	甲基		

编号	R ₁	R ₃	R ₁₆	Y	R ₁₇	R ₁₈	G ₉	物理数据
10.04	乙基	乙基	甲基			-H		
10.05	乙基	乙基	甲基	-CH ₂ -	甲基	甲基		
10.06	乙基	乙基	甲基	-CH ₂ -	甲基	-H		
10.07	乙基	乙基	乙基	-CH ₂ -	-(CH ₂) ₂ -			
10.08	乙基	乙炔基	甲基	-CH ₂ -	-H	甲基		
10.09	乙基	MeO-	甲基	-CH ₂ -	甲基	甲基		
10.10	乙基	乙基	甲基	O	甲基	-H	-H	
10.11	乙基	乙基	甲基	O	甲基	甲基	-H	
10.12	乙基	乙基	甲基	N-CH ₃	甲基	甲基	-H	
10.13	乙基	乙基	甲基			-H	-H	
10.14	乙基	乙基	甲基	-CH ₂ -	甲基	甲基	-H	
10.15	乙基	乙基	甲基	-CH ₂ -	甲基	-H	-H	
10.16	乙基	乙基	乙基	-CH ₂ -	-(CH ₂) ₂ -		-H	
10.17	乙基	乙炔基	甲基	-CH ₂ -	-H	甲基	-H	
10.18	乙基	MeO-	甲基	-CH ₂ -	甲基	甲基	-H	

在下表 21 中, Me 是甲基, Et 是乙基, Pr 是丙基和 Bu 是丁基。

表 21: 式 Im 化合物:



化合物 编号	R ₁	R ₃	R ₅₅	R ₁₃₇	R ₁₃₈	R ₁₃₉	G ₁₀	Y ₂	物理数 据
21.1	Et	Et	H	H	H	H	H	O	
21.2	Et	乙炔基	H	H	H	H	H	O	
21.3	Et	Et	Me	Me	Me	Me	H	O	
21.4	Et	OMe	Me	Me	Me	Me	H	O	
21.5	Et	Et	Me	H	H	H	H	O	
21.6	乙炔基	Et	Me	H	H	H	H	O	
21.7	Et	Et	H	H	Me	Me	H	O	
21.8	OMe	Et	H	H	Me	Me	H	O	
21.9	Et	Et	Me	H	Me	Me	H	O	
21.10	Et	乙炔基	Me	H	Me	Me	H	O	
21.11	Et	Et	H	Me	H	Me	H	O	
21.12	Et	OMe	H	Me	H	Me	H	O	
21.13	Et	Et	Me	Et	H	H	H	O	
21.14	乙炔基	Et	Me	Et	H	H	H	O	
21.15	Et	Et	H	Et	H	Et	H	O	
21.16	OMe	Et	H	Et	H	Et	H	O	
21.17	Et	Et	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	O	
21.18	Et	乙炔基	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	O	
21.19	Et	Et	H	H	H	H	COCMe ₃	O	
21.20	Et	乙炔基	H	H	H	H	SO ₂ Me	O	
21.21	Et	Et	Me	Me	Me	Me	COCMe ₃	O	
21.22	Et	OMe	Me	Me	Me	Me	SO ₂ - <i>n</i> -Pr	O	
21.23	Et	Et	Me	H	H	H	COCMe ₃	O	
21.24	乙炔基	Et	Me	H	H	H	SO ₂ - <i>n</i> -Bu	O	
21.25	Et	Et	H	H	Me	Me	COCMe ₃	O	
21.26	OMe	Et	H	H	Me	Me	SO ₂ C ₈ H ₁₇	O	
21.27	Et	Et	Me	H	Me	Me	COCMe ₃	O	
21.28	Et	乙炔基	Me	H	Me	Me	SO ₂ Ph	O	
21.29	Et	Et	H	Me	H	Me	COCMe ₃	O	
21.30	Et	OMe	H	Me	H	Me	SO ₂ Me	O	
21.31	Et	Et	Me	Et	H	H	COCMe ₃	O	
21.32	乙炔基	Et	Me	Et	H	H	COCMe ₃	O	
21.33	Et	Et	H	Et	H	Et	COCMe ₃	O	
21.34	OMe	Et	H	Et	H	Et	COCMe ₃	O	
21.35	Et	Et	H	H	-(CH ₂) ₄ -		COCMe ₃	O	
21.36	Et	乙炔基	H	H	-(CH ₂) ₄ -		COCMe ₃	O	
21.37	Et	Et	H	H	H	H	H	S	
21.38	Et	乙炔基	H	H	H	H	H	S	
21.39	Et	Et	Me	Me	Me	Me	H	S	
21.40	Et	OMe	Me	Me	Me	Me	H	S	
21.41	Et	Et	Me	H	H	H	H	S	
21.42	乙炔基	Et	Me	H	H	H	H	S	
21.43	Et	Et	H	H	Me	Me	H	S	
21.44	OMe	Et	H	H	Me	Me	H	S	
21.45	Et	Et	Me	H	Me	Me	H	S	
21.46	Et	乙炔基	Me	H	Me	Me	H	S	
21.47	Et	Et	H	Me	H	Me	H	S	
21.48	Et	OMe	H	Me	H	Me	H	S	
21.49	Et	Et	Me	Et	H	H	H	S	
21.50	乙炔基	Et	Me	Et	H	H	H	S	

化合物 编号	R ₁	R ₃	R ₅₅	R ₁₃₇	R ₁₃₈	R ₁₃₉	G ₁₀	Y ₂	物理数 据
21.51	Et	Et	H	Et	H	Et	H	S	
21.52	OMe	Et	H	Et	H	Et	H	S	
21.53	Et	Et	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	S	
21.54	Et	乙炔基	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	S	
21.55	Et	Et	H	H	H	H	COCMe ₃	S	
21.56	Et	乙炔基	H	H	H	H	SO ₂ Me	S	
21.57	Et	Et	Me	Me	Me	Me	COCMe ₃	S	
21.58	Et	OMe	Me	Me	Me	Me	SO ₂ - <i>n</i> -Pr	S	
21.59	Et	Et	Me	H	H	H	COCMe ₃	S	
21.60	乙炔基	Et	Me	H	H	H	SO ₂ - <i>n</i> -Bu	S	
21.61	Et	Et	H	H	Me	Me	COCMe ₃	S	
21.62	OMe	Et	H	H	Me	Me	SO ₂ C ₈ H ₁₇	S	
21.63	Et	Et	Me	H	Me	Me	COCMe ₃	S	
21.64	Et	乙炔基	Me	H	Me	Me	SO ₂ Ph	S	
21.65	Et	Et	H	Me	H	Me	COCMe ₃	S	
21.66	Et	OMe	H	Me	H	Me	SO ₂ Me	S	
21.67	Et	Et	Me	Et	H	H	COCMe ₃	S	
21.68	乙炔基	Et	Me	Et	H	H	COCMe ₃	S	
21.69	Et	Et	H	Et	H	Et	COCMe ₃	S	
21.70	OMe	Et	H	Et	H	Et	COCMe ₃	S	
21.71	Et	Et	H	H	-(CH ₂) ₄ -		COCMe ₃	S	
21.72	Et	乙炔基	H	H	-(CH ₂) ₄ -		COCMe ₃	S	
21.73	Et	Et	H	H	H	H	H	NCH(CH ₃) ₂	
21.74	Et	Et	H	H	H	H	H	NCH ₃	
21.75	Et	Et	H	H	H	H	H	NCH ₂ Ph	
21.76	Et	乙炔基	H	H	H	H	H	NCH ₃	
21.77	Et	Et	Me	Me	Me	Me	H	NCH(CH ₃) ₂	
21.78	Et	OMe	Me	Me	Me	Me	H	NCH ₃	
21.79	Et	Et	Me	H	H	H	H	NCH(CH ₃) ₂	
21.80	乙炔基	Et	Me	H	H	H	H	NCH ₃	
21.81	Et	Et	H	H	Me	Me	H	NCH ₃	
21.82	OMe	Et	H	H	Me	Me	H	NCH(CH ₃) ₂	
21.83	Et	Et	Me	H	Me	Me	H	NCH ₂ Ph	
21.84	Et	乙炔基	Me	H	Me	Me	H	NCH ₃	
21.85	Et	Et	H	Me	H	Me	H	NCH ₂ Ph	
21.86	Et	OMe	H	Me	H	Me	H	NCH ₃	
21.87	Et	Et	Me	Et	H	H	H	NCH(CH ₃) ₂	
21.88	乙炔基	Et	Me	Et	H	H	H	NCH ₃	
21.89	Et	Et	H	Et	H	Et	H	NCH ₂ Ph	
21.90	OMe	Et	H	Et	H	Et	H	NCH(CH ₃) ₂	
21.91	Et	Et	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	NCH(CH ₃) ₂	
21.92	Et	乙炔基	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	NCH ₃	
21.93	OMe	Et	Et	Me	H	H	H	NCH ₃	
21.94	Et	Et	H	H	H	H	COCMe ₃	NCH(CH ₃) ₂	
21.95	Et	Et	H	H	H	H	SO ₂ Me	NCH ₃	
21.96	Et	Et	H	H	H	H	COCMe ₃	NCH ₂ Ph	
21.97	Et	乙炔基	H	H	H	H	SO ₂ - <i>n</i> -Pr	NCH ₃	
21.98	Et	Et	Me	Me	Me	Me	COCMe ₃	NCH(CH ₃) ₂	
21.99	Et	OMe	Me	Me	Me	Me	SO ₂ - <i>n</i> -Bu	NCH ₃	
21.100	Et	Et	Me	H	H	H	COCMe ₃	NCH(CH ₃) ₂	

化合物 编号	R ₁	R ₃	R ₅₅	R ₁₃₇	R ₁₃₈	R ₁₃₉	G ₁₀	Y ₂	物理数 据
21.101	乙炔基	Et	Me	H	H	H	SO ₂ C ₈ H ₁₇	NCH ₃	
21.102	Et	Et	H	H	Me	Me	COCMe ₃	NCH ₃	
21.103	OMe	Et	H	H	Me	Me	SO ₂ Ph	NCH(CH ₃) ₂	
21.104	Et	Et	Me	H	Me	Me	COCMe ₃	NCH ₂ Ph	
21.105	Et	乙炔基	Me	H	Me	Me	SO ₂ Me	NCH ₃	
21.106	Et	Et	H	Me	H	Me	COCMe ₃	NCH ₂ Ph	
21.107	Et	OMe	H	Me	H	Me	COCMe ₃	NCH ₃	
21.108	Et	Et	Me	Et	H	H	COCMe ₃	NCH(CH ₃) ₂	
21.109	乙炔基	Et	Me	Et	H	H	COCMe ₃	NCH ₃	
21.110	Et	Et	H	Et	H	Et	COCMe ₃	NCH ₂ Ph	
21.111	OMe	Et	H	Et	H	Et	COCMe ₃	NCH(CH ₃) ₂	
21.112	Et	Et	H	H	-(CH ₂) ₄ -		COCMe ₃	NCH(CH ₃) ₂	
21.113	Et	乙炔基	H	H	-(CH ₂) ₄ -		SO ₂ C ₈ H ₁₇	NCH ₃	
21.114	OMe	Et	Et	Me	H	H	SO ₂ - <i>n</i> -Bu	NCH ₃	
21.115	Et	Et	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH ₂	
21.116	Et	乙炔基	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH ₂	
21.117	Et	Et	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H	CH ₂	
21.118	Et	OMe	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H	CH ₂	
21.119	Et	Et	H	Me	Me	H	H	CH ₂	
21.120	乙炔基	Et	H	Me	Me	H	H	CH ₂	
21.121	Et	Et	Et	H	H	H	H	CH ₂	
21.122	OMe	Et	Et	H	H	H	H	CH ₂	
21.123	Et	Et	H	H	Me	Me	H	CH ₂	
21.124	Et	乙炔基	H	H	Me	Me	H	CH ₂	
21.125	Et	Et	H	OMe	H	H	H	CH ₂	
21.126	Et	OMe	H	OMe	H	H	H	CH ₂	
21.127	Et	Et	H	-(CH ₂) ₃ -		H	H	CH ₂	
21.128	乙炔基	Et	H	-(CH ₂) ₃ -		H	H	CH ₂	
21.129	Et	Et	Me	H	Me	Me	H	CH ₂	
21.130	OMe	Et	Me	H	Me	Me	H	CH ₂	
21.131	Et	Et	Me	OMe	H	H	H	CH ₂	
21.132	Et	乙炔基	Me	OMe	H	H	H	CH ₂	
21.133	Et	Et	H	SMe	H	H	H	CH ₂	
21.134	Et	OMe	H	SMe	H	H	H	CH ₂	
21.135	Et	Et	Me	Me	Me	Me	H	CH ₂	
21.136	乙炔基	Et	Me	Me	Me	Me	H	CH ₂	
21.137	Et	Et	OH	Me	Me	Me	H	CH ₂	
21.138	OMe	Et	OH	Me	Me	Me	H	CH ₂	
21.139	Et	Et	Me	SMe	H	H	H	CH ₂	
21.140	Et	乙炔基	Me	SMe	H	H	H	CH ₂	
21.141	Et	Et	Et	Et	H	Me	H	CH ₂	
21.142	Et	乙炔基	Et	Et	H	Me	H	CH ₂	
21.143	Et	Et	Me	Me	H	CH ₂ OMe	H	CH ₂	
21.144	Et	OMe	Me	Me	H	CH ₂ OMe	H	CH ₂	
21.145	Et	乙炔基	Me	SMe	H	OMe	H	CH ₂	
21.146	Et	Et	Me	SMe	H	OMe	H	CH ₂	
21.147	Et	OMe	Me	SMe	H	OMe	H	CH ₂	
21.148	Et	Et	H	-(CH ₂) ₂ -		H	COCMe ₃	CH ₂	
21.149	Et	乙炔基	H	-(CH ₂) ₂ -		H	COCMe ₃	CH ₂	
21.150	Et	Et	-(CH ₂) ₂ -		H	H	SO ₂ - <i>n</i> -Pr	CH ₂	

化合物 编号	R ₁	R ₃	R ₅₅	R ₁₃₇	R ₁₃₈	R ₁₃₉	G ₁₀	Y ₂	物理数 据
21.151	Et	OMe	-(CH ₂) ₂ -		H	H	COCMe ₃	CH ₂	
21.152	Et	Et	H	Me	Me	H	COCMe ₃	CH ₂	
21.153	乙炔基	Et	H	Me	Me	H	SO ₂ Me	CH ₂	
21.154	Et	Et	Et	H	H	H	COCMe ₃	CH ₂	
21.155	OMe	Et	Et	H	H	H	SO ₂ - <i>n</i> -Pr	CH ₂	
21.156	Et	Et	H	H	Me	Me	COCMe ₃	CH ₂	
21.157	Et	乙炔基	H	H	Me	Me	SO ₂ - <i>n</i> -Bu	CH ₂	
21.158	Et	Et	H	OMe	H	H	COCMe ₃	CH ₂	
21.159	Et	OMe	H	OMe	H	H	SO ₂ C ₈ H ₁₇	CH ₂	
21.160	Et	Et	H	-(CH ₂) ₃ -		H	COCMe ₃	CH ₂	
21.161	乙炔基	Et	H	-(CH ₂) ₃ -		H	COCMe ₃	CH ₂	
21.162	Et	Et	Me	H	Me	Me	SO ₂ - <i>n</i> -Pr	CH ₂	
21.163	OMe	Et	Me	H	Me	Me	COCMe ₃	CH ₂	
21.164	Et	Et	Me	OMe	H	H	COCMe ₃	CH ₂	
21.165	Et	乙炔基	Me	OMe	H	H	SO ₂ Me	CH ₂	
21.166	Et	Et	H	SMe	H	H	COCMe ₃	CH ₂	
21.167	Et	OMe	H	SMe	H	H	SO ₂ - <i>n</i> -Pr	CH ₂	
21.168	Et	Et	Me	Me	Me	Me	COCMe ₃	CH ₂	
21.169	乙炔基	Et	Me	Me	Me	Me	SO ₂ - <i>n</i> -Bu	CH ₂	
21.170	Et	Et	OH	Me	Me	Me	COCMe ₃	CH ₂	
21.171	OMe	Et	OH	Me	Me	Me	SO ₂ C ₈ H ₁₇	CH ₂	
21.172	Et	Et	Me	SMe	H	H	COCMe ₃	CH ₂	
21.173	Et	乙炔基	Me	SMe	H	H	COCMe ₃	CH ₂	
21.174	Et	Et	Et	Et	H	Me	COCMe ₃	CH ₂	
21.175	Et	乙炔基	Et	Et	H	Me	SO ₂ C ₈ H ₁₇	CH ₂	
21.176	Et	Et	Me	Me	H	CH ₂ OMe	SO ₂ - <i>n</i> -Pr	CH ₂	
21.177	Et	OMe	Me	Me	H	CH ₂ OMe	COCMe ₃	CH ₂	
21.178	Et	乙炔基	Me	SMe	H	OMe	COCMe ₃	CH ₂	
21.179	Et	Et	Me	SMe	H	OMe	SO ₂ C ₈ H ₁₇	CH ₂	
21.180	Et	OMe	Me	SMe	H	OMe	COCMe ₃	CH ₂	
21.181	Et	Et	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	CHCH ₃	
21.182	Et	乙炔基	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	CHCH ₃	
21.183	Et	Et	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H	CHCH ₃	
21.184	Et	OMe	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H	CHCH ₃	
21.185	Et	Et	H	Me	Me	H	H	CHCH ₃	
21.186	乙炔基	Et	H	Me	Me	H	H	CHCH ₃	
21.187	Et	Et	Et	H	H	H	H	CHCH ₃	
21.188	OMe	Et	Et	H	H	H	H	CHCH ₃	
21.189	Et	Et	H	H	Me	Me	H	CHCH ₃	
21.190	Et	乙炔基	H	H	Me	Me	H	CHCH ₃	
21.191	Et	Et	H	-(CH ₂) ₂ -		H	COCMe ₃	CHCH ₃	
21.192	Et	乙炔基	H	-(CH ₂) ₂ -		H	COCMe ₃	CHCH ₃	
21.193	Et	Et	-(CH ₂) ₂ -		H	H	SO ₂ - <i>n</i> -Pr	CHCH ₃	
21.194	Et	OMe	-(CH ₂) ₂ -		H	H	COCMe ₃	CHCH ₃	
21.195	Et	Et	H	Me	Me	H	COCMe ₃	CHCH ₃	
21.196	乙炔基	Et	H	Me	Me	H	SO ₂ Me	CHCH ₃	
21.197	Et	Et	Et	H	H	H	COCMe ₃	CHCH ₃	
21.198	OMe	Et	Et	H	H	H	SO ₂ - <i>n</i> -Pr	CHCH ₃	
21.199	Et	Et	H	H	Me	Me	COCMe ₃	CHCH ₃	
21.200	Et	乙炔基	H	H	Me	Me	SO ₂ - <i>n</i> -Bu	CHCH ₃	

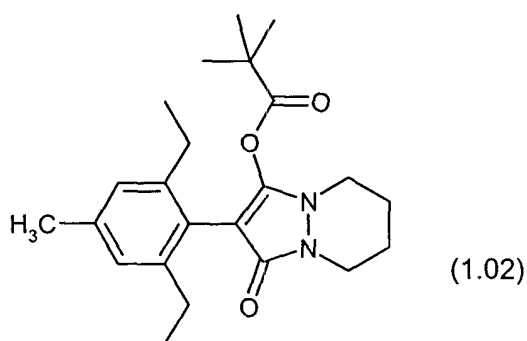
化合物编号	R ₁	R ₃	R ₅₅	R ₁₃₇	R ₁₃₈	R ₁₃₉	G ₁₀	Y ₂	物理数据
21.201	Et	Et	H		-(CH ₂) ₂ -	H	H	C(CH ₃) ₂	
21.202	Et	乙炔基	H		-(CH ₂) ₂ -	H	H	C(CH ₃) ₂	
21.203	Et	Et		-(CH ₂) ₂ -	H	H	H	C(CH ₃) ₂	
21.204	Et	OMe		-(CH ₂) ₂ -	H	H	H	C(CH ₃) ₂	
21.205	Et	Et	H	Me	Me	H	H	C(CH ₃) ₂	
21.206	乙炔基	Et	H	Me	Me	H	H	C(CH ₃) ₂	
21.207	Et	Et	Et	H	H	H	H	C(CH ₃) ₂	
21.208	OMe	Et	Et	H	H	H	H	C(CH ₃) ₂	
21.209	Et	Et	H		-(CH ₂) ₂ -	H	COCMe ₃	C(CH ₃) ₂	
21.210	Et	乙炔基	H		-(CH ₂) ₂ -	H	COCMe ₃	C(CH ₃) ₂	
21.211	Et	Et		-(CH ₂) ₂ -	H	H	SO ₂ - <i>n</i> -Pr	C(CH ₃) ₂	
21.212	Et	OMe		-(CH ₂) ₂ -	H	H	COCMe ₃	C(CH ₃) ₂	
21.213	Et	Et	H	Me	Me	H	COCMe ₃	C(CH ₃) ₂	
21.214	乙炔基	Et	H	Me	Me	H	SO ₂ Me	C(CH ₃) ₂	
21.215	Et	Et	Et	H	H	H	COCMe ₃	C(CH ₃) ₂	
21.216	OMe	Et	Et	H	H	H	SO ₂ - <i>n</i> -Pr	C(CH ₃) ₂	
21.217	Et	Et	Me	Me	Me	Me	H	CHCO ₂ Me	
21.218	Et	Et	H	H	H	H	H	CHCO ₂ Me	
21.219	Et	Et	Me	Me	Me	Me	COCMe ₃	CHCO ₂ Me	
21.220	Et	Et	H	H	H	H	COCMe ₃	CHCO ₂ Me	
21.221	Et	OMe		-(CH ₂) ₂ -	H	H	H	CHCO ₂ Me	
21.222	Et	OMe		-(CH ₂) ₂ -	H	H	COCMe ₃	CHCO ₂ Me	

生物试验实施例

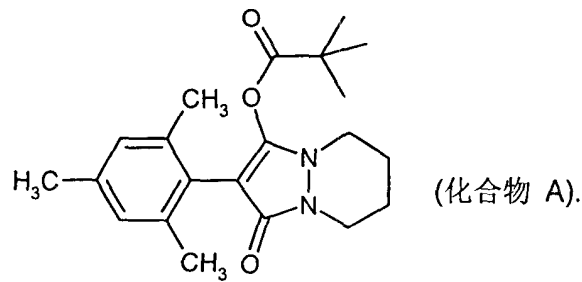
比较试验：

试验下述化合物的除草活性：

按照本发明的化合物编号. 1.02



和化合物 A



实施例 B1: 植物发芽前的除草活性 (芽前作用)

在塑料盆的标准土壤中种植单子叶和双子叶杂草。种植后立即把实验物质以水悬浮液(由 25 % 可湿性粉剂(实施例F3, b)制备)或乳液(由25 % 乳油(实施例F1, c)制备)的形式施用(500升水/ha)。施用量为500g活性物质/公顷。试验植物然后在温室中于最佳条件下生长。评价在施用三周后进行, 用9个等级评价(1 =全部毁坏, 9 = 无作用)。等级1- 4 (特别是1- 3) 表明除草活性好至非常好。试验植物是: 看麦娘属 (Alo), 燕麦属 (Ave), 黑麦草属 (Lol), 狗尾草属 (Set), 黍属 (Pan), 高粱属 (Sor), 马唐属 (Dig), 稗属 (Ech) 和臂形草属 (Bra)。

表 B1: 芽前作用:

施用量为 500g 活性成分/公顷时的芽前作用

化合物编号	Alo	Ave	Lol	Set	Pan	Sor	Dig	Ech	Bra
化合物 A	2	4	1	2	1	4	4	5	3
1.02	1	1	1	1	1	1	4	1	1

实施例 B2: 植物苗后的除草作用(苗后作用):

于温室条件下, 在塑料盆的标准土壤中种植单子叶量为和双子叶杂草。在3-6叶期给实验植物施用实验物质。试验物质的施用量为500g活性物质/公顷。施用形式是水悬浮液(由 25 % 可湿性粉剂(Example F3, b)制备)或乳液(由25 % 乳油(Example F1, c)制备) (500升水/

公顷)。评价在施用三周后进行，用9个等级评价(1=全部毁坏，9=无作用)。等级1-4(特别是1-3)表明除草活性好至非常好。

试验植物是：看麦娘属(Alo)，燕麦属(Ave)，黑麦草属(Lol)，狗尾草属(Set)，黍属(Pan)，高粱属(Sor)，马唐属(Dig)，稗属(Ech)和臂形草属(Bra)。

表 B2: 苗后作用:

施用量为 250g 活性成分/公顷时的苗后作用

化合物编号	Alo	Ave	Lol	Set	Pan	Sor	Dig	Ech	Bra
化合物 A	3	3	2	2	1	3	2	1	2
1.02	1	1	1	1	1	1	2	1	1

将化合物 A 与本发明化合物 No. 102 进行比较可以看出，出人意料的，虽然化合物 No. 102 与化合物 A 的不同仅仅在于两个乙基被甲基所代替，但是它对所有的试验杂草的除草活性均有显著提高。

实施例 B3: 本发明化合物在植物发芽前的除草活性(芽前作用):

在塑料盆的标准土壤中种植单子叶和双子叶杂草。种植后立即把实验物质以水悬浮液(由 25% 可湿性粉剂(Example F3, b)制备)或乳液(由 25% 乳油(Example F1, c)制备)的形式施用(500升水/公顷)。施用量为 500g 活性物质/公顷。然后试验植物在温室中于最佳条件下生长。评价在施用三周后进行，用9个等级评价(1=全部毁坏，9=无作用)。等级1-4(特别是1-3)表明除草活性好至非常好。试验植物是：燕麦属(Ave)、黑麦草属(Lol)、狗尾草属(Set)。

表 B3: 芽前作用: 在浓度为0.7%重量的喷雾混合物中用MERGE®作为油添加剂:

化合物编号	试验植物:		
	Ave	Lol	Set
1.01	1	1	1
1.02	1	1	1
1.31	1	1	2
1.35	1	1	1

当式I化合物被加工制成实施例F2和F4 - F8的制剂时, 得到同样的结果。

实施例 B4: 本发明化合物的植物苗后除草活性(苗后作用) (如实施例 B2所述):

试验植物: 燕麦属 (Ave), 黑麦草属 (Lol), 狗尾草属 (Set)。结果见下表4。

表B4: 苗后作用: 在浓度为0.7%重量的喷雾混合物中用MERGE®作为油添加剂。

化合物编号	实验植物:		
	Ave	Lol	Set
1.01	1	1	1
1.02	1	1	1
1.04	1	1	1
1.05	1	3	1
1.07	1	1	1
1.08	1	1	1
1.10	1	1	1
1.11	1	1	1
1.14	1	2	2
1.15	1	2	1
1.17	1	1	2
1.19	1	1	1
1.21	1	1	1

化合物编号	实验植物:		
	Ave	Lol	Set
1.23	1	1	1
1.26	1	2	1
1.27	1	1	2
1.30	1	1	1
1.31	1	1	1
1.35	1	1	1
1.37	1	1	1
1.39	1	1	1
1.40	1	1	2
1.43	1	2	2

当式 I 化合物被加工制成实施例 F2 和 F4 - F8 的制剂时, 得到同样的结果。